	表105	
実施例	式	MS
番号		
1193	HO CH ₃	512(M+H)
		504(M+H)
1194	HO HO Br	334(8871)
		516(M+H)
1195	HO	
1196	O CH.	497(M+H)
	HO CH ₃	
1197	HO NOME	456(M+H)
1198	HO NO	509(M+H)

	表100	110
実施例 番号	式	MS
1199	HO CH ₃	483(M+H)
1200	HO N	427(M+H)
1201	HO NO	427(M+H)
1202	HO NO	477(M+H)
1203	HO S O CH ₃	519(M+H)
1204	HO NO	440(M+H)

	表107	
実施例 番号	式	MS
1205	HO NO	454(M+H)
1206	HO N F	325(M+H)
1207	HO N CI	341(M+H)
1208	HO N Br	385(M+H)
1209	HO CH ₃	363(M+H)
1210	HO N CN	332(M+H)

STATE AND I	式	MS
実施例	Σζ,	IVIO
番号		351(M+H)
1211	O II	331(WTT)
1		1. 1
] [но	
	N	
,		1 1
1212	0	335(M+H)
12.2	Ĭ	` '
	HON	
	CH3	
1213	ρ	349(M+H)
	N / CH ₃	
	HO N ON 3	
	N CH ³	
 		
İ		
1214		321(M+H)
1214	l I	02.()
	N (=)	
	HO CH ₃	1
1215	Q	375(M+H)
	↓ ↓ ∧ N ← F	
	HO	
	N F F	
	<u> </u>	
1		
1216	0	367(M+H)
1210		1
	N /	
	HO	
	0—	
	ОН	
1		

· ==+= /=1	式109	MS
実施例 番号	77	
1217	Q	433(M+H)
''		
	но	
	CI CI	
1218	0	391(M+H)
1210		
	HO	
	f F	
4040		337(M+H)
1219	n n	
	HO	1
1		1
	l di	
	O-CH ₃	}
		30E(M), LL)
1220) n	385(M+H)
	HON	
	N W	
	Br	
		341(M+H)
1221		341 (IVITI I)
	N /	
	HO	
	N N	
	CI	
1		
		1000(88:11)
1222	Q	332(M+H)
	N /	
	HO	
}	N V	
	CN	

表1	1	C
----	---	---

生	施例	表 TIU	MS
7	等号	·	395(M+H)
1	223	HO CH ₃	
	224	0	375(M+H)
		HO CI	351(M+H)
	1225		351(IVIT1)
,		HO CH ₃	224 (M) (H)
	1226	0	321(M+H)
		HO CH ₃	
r	1227	О Н	426(M+H)
		HO	
-	1228	О Н	460(M+H)
	٠	HO NO CI	

実施例		MS
表 题 例 图 图 图 图 图 图 图 图 图 图 图 图 图 图 图 图 图 图	المند	
1229	HO NO	442(M+H)
1230	HO CH ₃	468(M+H)
1231	HO HO OH	456(M+H)
1232	HO HO CI	494(M+H)
1233	HO CN	451(M+H)
1234	HO CH ₃	468(M+H)

実施例	式 式	MS
番号		
1235	HO CH ₃	498(M+H)
1236	HON	476(M+H)
1237	HO NO	502(M+H)
1238	HO NH	
1239	HO NH ₂	469(M+H)

表1	1	3

実施例	表113 式	MS
关	planty.	
1240	HO N N	483(M+H)
1241	но	408(M+H)
1242	HO HO CI	460(M+H)
1243	HO CH ₃	468(M+H)
1244	HO F F	494(M+H)
1245	HO H ₃ C H ₃ C CH ₃	454(M+H)

77	114

rt +- 101	表114	MS
実施例 番号	工,	IVIO
1246	H₃C	468(M+H)
	` >	
	HO N N	
	N O	
1247	0	498(M+H)
	но	
	N CH ₃	}
1248	0	482(M+H)
1240	CH ₃	
	H ₃ C CH ₃	
	N O N'30 Tr'3	
		469(M11LI)
1249	H ₃ C	468(M+H)
	CH ₃	
	HO	
	N N	
1050	C	460(M+H)
1250	CI	-100(11111)
1	0,	
	P	
	HO N H	
	N S	
1		

	表115	
実施例 番号	式	MS
1251	HO N	442(M+H)
1252	HO TH3	468(M+H)
1253	но	456(M+H)
1254	HO N CI	494(M+H)

_	表116	
実施例 番号	式	MS
1255	HO N HO	451(M+H)
1256	HO CH ₃	468(M+H)
1257	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	498(M+H)
1258	HO	470(M+H)

	表117	1 1/2
実施例 番号	式	MS
1259	HO NH	476(M+H)
1260	HO TO THE TOTAL PROPERTY OF THE TOTAL PROPER	502(M+H)
1261	HO NH ₂	505(M+H)
1262	HO NH ₂	469(M+H)

3/000254		
	表118	
実施例	式	MS
番号		483(M+H)
1263	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	
1264	<i>"</i>	408(M+H)
	но	460(M11)
1265	· CI	460(M+H)
	HO N	
1266	CH ₃	468(M+H)
·	HO	

3/000254		1 C1/31 02/00
	表119	
実施例 番号	式	MS
1267	HO N	494(M+H)
1268	CH ₃	454(M+H)
1269	HO CH ₃	468(M+H)
1270	HO N N CH ₃	498(M+H)

WO 03/000254

	表120	MS
実施例 番号	式	1010
1271	H ₃ C(482(M+H)
	. CH,	
	CH ₃	
	/ >	
	0,	
	Ĥ Ĥ	
	HO N	
1272	CH ₃	468(M+H)
	\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	
	° CH₃	
	l i	
	HO	
1273	Cl	494(M+H)
1275		
	/ \	
	0,	
)	
	HO	
1274	/O-CH ₃	484(M+H)
	, 0, > 0	
) N	
	HON	

ata de tra	表121	MC
実施例 番号	式	MS
1275	HO CH ₃	519(M+H)
1276	HO N	427(M+H)
1277	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	456(M+H)
1278	HO N	516(M+H)

	a	22
नप्ट	1	22

cb++-101	五	MS
実施例 番号		IVIO
1279	O CH ₃	436(M+H)
	9,	
) NH	
	HO N H	
1280		426(M+H)
	9	
	HO	
	N C	
1001		440(M+H)
1281		440(101 1 1)
	HO	
	N	
1282		454(M+H)
	9, /	
)) h	
	HON	
		100(1111)
1283		468(M+H)
	0,	
	Ŋ ≯Ŋ	
	но	
	N	

	表123	1 100
実施例	式	MS
番号		482(M+H)
1284		402(101717)
	<u>`_</u> `	
	9 /	
)	
	но	
	N C	
		406(M+H)
1285	CH ₃	400(101711)
) \rightarrow Yi	
	HO N	
4000	CH CH	420(M+H)
1286	H ₃ C CH ₃	420(101.11)
	N CH₃	1
	но	
4007	C	508(M+H)
1287	CI	000(10111)
	o,cı	
	\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	
	N H	
	HO	
	\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	
1288		508(M+H)
,		
	0.	
1		
	HO	
L		

	表124	
実施例 番号	式	MS
1289	HO	509(M+H)
1290	HO N	455(M+H)
1291	HO N H	494(M+H)
1292	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	418(M+H)

	表125	
実施例 番号	式	MS
1293	HO N	490(M+H)
1294	HO N H ₃ C CH ₃	496(M+H)
1295	HO N	477(M+H)
1296	HO N.	508(M+H)
1297	HO CH ₃	470(M+H)

	表126	1 110
実施例 番号	式	MS
1298	HO N CH ₃	435(M+H)
1299	HO	488(M+H)
1300	HO CH ₃	454(M+H)
1301	HO N H	504(M+H)

	表127	,
実施例 番号	式	MS
1302	H₃C ►O	513(M+H)
	HN	
	O N O—CH ₃	
	HON	
1303	0	399(M+H)
	HO NO	
1304		530(M+H)
	HO N	
1305	H₃C(504(M+H)
	HO N N	The state of the s
1306	H ₃ C /	440(M+H)
	HO N	

	表128	
実施例 番号	式	MS
1307	HO CI	494(M+H)
1308	HO NO	508(M+H)
1309	HO NO	518(M+H)
1310	HO	532(M+H)
1311	HO CI	522(M+H)

	表129	
実施例 番号	式	MS
1312	HO CH ₃	546(M+H)
1313	HO N	484(M+H)
1314	HO NO CI	517(M+H)
1315	HO N	488(M+H)
1316	HO CI	481(M+H)

完1	เรก
48	JU

	表130	1 110
実施例 番号	式	MS
1317	HO	413(M+H)
1318	HO	423(M+H)
1319	HO NO	504(M+H)
1320	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	510(M+H)
1321	HO N CI	522(M+H)
1322	HO N N P F F	522(M+H)

	表131	
実施例 番号	式	MS
1323	HO N N O CH ₃	484(M+H)
1324	HO N CH ₃	449(M+H)
1325	HO N CI	502(M+H) ·
1326	HO N	491(M+H)
1327	H ₃ C CH ₃ CH ₃	496(M+H)

	表132	BAC 1
実施例 番号	式	MS
1328	0	497(M+H)
	HO N O	
	s s	
	N N	
	N	
1329	Q	470(M+H)
	N / O	
	HO	
	N H	
	но	
1330	O C	530(M+H)
	HO	
	N H	
1331	CI	502(M+H)
	9, //	
	Ŋ Ŋ	
ĺ	HO	
	N	
1000		522(M+H)
1332		J. Z. ((VI - 1 /)
	HON	
	M M	
	CI	
		_1

ch++- rol		MS
実施例 番号	工 工	IVIO
1333		491(M+H)
	o, >=< "N	
	HO N H	
	N C	
1334	9	536(M+H)
100-		
	HO CI,	
	a la	
1335	Q I	547(M+H)
	HO N P	
	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	
	" S NH ₂	
1336		484(M+H)
1330		104(11111)
	но	
	N	
	ОН	
1337	O O	484(M+H)
	HO NO	
	I ji	
	CH ₃	
1338	0	498(M+H)
	HO N /	
	J H	
,		

	表134	1 10
実施例	式	MS
番号		528(M+H)
1339		320(W111)
	HO N]]
	11 1 \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	
	CH₃	
]
	<i></i>	
	н"с	
1340	0	498(M+H)
	HO N /]
	, o	
	н₃с′	
1341	Q	514(M+H)
	HO	
	N N	
	\ \ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\	
	CH ₃	
Ì	Ó	
	O CH ₃	
1342	O	513(M+H)
	HO	
	N N N	1
	NO ₂	
1343	O	488(M+H)
	N Ø	
	HON	
	N— CI	
1011		502(M+H)
1344		(ועודרו)
	HO NO	
		1
	N N N	
	\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	
1		
L		

	表135	
実施例 番号	五	MS
1345	0	488(M+H)
	но	
	M H	
	()	
1346))	502(M+H)
1340		302(101-11)
	НО	
	N	
	$H \subset \overline{}$	
		100(11:11)
1347		499(M+H)
	HO NO	
	\backslash	
	2	
1348	O	480(M+H)
	HO N P	
1349	Q	522(M+H)
	HO N / N	0
-		
	N N	
1		
	FF	
1350	0	546(M+H)
	HO	
	H Br	

	表136	
実施例 番号	式	MS
1351	Q	482(M+H)
	HO N CH ₃	
1352	O II	484(M+H)
	HO H ₃ C CH ₃	
1353	ρ .	609(M+H)
	HO THO CH ₃	
1354	HO NO	532(M+H)
1355		480(M+H)
	HO NH	
1356	Ŷ	566(M+H)
	HO NO CI	

表	1	3	7
-		v	£

実施例	式 37	MS
番号		
1357	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	602(M+H)
1358	Q	596(M+H)
	HO HO N N N N N N N N N N N N N N N N N	
1359	0	491(M+H)
	HO	
1360	0	491(M+H)
	HO	
1361	0	491(M+H)
	HO N	
1362	O II	496(M+H)
	HO CH ₃	

実施例		MS
番号	<u>Д</u> ,	""
1363	HO NO CH ₃	512(M+H)
1364	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	494(M+H)
1365	HO N CI	488(M+H)
1366	HO NH NH	481(M+H)
1367	но	524(M+H)
1368	HO S N	497(M+H)

	4	20	
70	ı	മൗ	

retorable Irol		MS
実施例 番号	Σ/,	
1369	Q	472(M+H)
	но	
	M M	
	" \	
	₩ N	
1370	· ·	469(M+H)
	HO NO	
1371	Q Q	470(M+H)
	HO N /	
1.		
	N N	
	`CH₃	
1372	0	469(M+H)
	HO N O	
	. 🗸	
1373	0	494(M+H)
	HO N /	
	The state of the s	
1374	0	458(M+H)
	HO	
	N N NH	

rhite mi	表140	Ms
実施例 番号	式	IVIS
1375	HO CI	612(M+H)
		EE A(NA ; LI)
1376	HO CH ₃	554(M+H)
1377	0	542(M+H)
	HO N O-CH ₃ CH ₃	
1378	HO HO	526(M+H)
1379	0	496(M+H)
	HO N N O CH ₃ C CH ₃	
1380	но	510(M+H)
,	CH ₃	

	表141	1 112
実施例 番号	式	MS
1381	HO N CH ₃	540(M+H)
1382	HO CH ₃	525(M+H)
1383	HO N	558(M+H)
1384	HO N H H CI	523(M+H)
1385	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	539(M+H)

	表142	
実施例 番号	式	MS
1386	Q II	533(M+H)
	HO N P	
	II / H	
	H CH3	
	H ₃ C-O S	
1387	Q.	500(M+H)
	HO N / N	
	The Later than the second seco	
	H H	
1388	NO ₂	485(M+H)
1000	N \bigcirc 0	
	HO T	
	N-H	
	, H₃C	
1389	n _g o	523(M+H)
1303		
	N H CI	
	CI	
1390	Q	512(M+H)
	HO N /	
	H	
	H H N	
	s s	

#	1	A	3
70			

	衣143	MC
実施例 番号	式	MS
1391	HO NO	540(M+H)
	H-H-CI	
1202	N N	527(M+H)
1392	HO H ₃ C	
1393	9	525(M+H)
	HO N F	
	N F F	507/44-110
1394	N / O	507(M+H)
	HO N-H	
1395	0	491(M+H)
	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	-
1396	ÇI Q	506(M+H)
	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	
•		

実施例		MS
番号	- V	
1397	0	522(M+H)
	H	
	но	
	H H	
	()	
4000	Q'	538(M+H)
1398		330(101711)
	HO N / N	
	N N	
	O. F.	
	F	
	_/	
1399	F	522(M+H)
1000		
	но	
	N CI	
	N CI	
	· >=/	
	Cl'	50001.15
1400		530(M+H)
1	HO N N	
	, N — H—	
1401	O O	600(M+H)
	HO	
	() (
	CI————————————————————————————————————	
	Cl	
1402	0	504(M+H)
	CH ₃	1 ` ′
	1 HO Y Y \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	
	N CH3	
	H N N N S 13	
L		

	表145	1 110
実施例 番号	式	MS
1403	O	534(M+H)
	HO N O-CH ₃	
	N	
	. Н	
	Н₃с—о	
1404	Q	475(M+H)
	HO N	
	The state of the s	
1405	9 H	472(M+H)
	HO	
	N ZIV	
1406		455(M+H)
1400		
	HONN	
	N	
1407	9 ~ #	469(M+H)
	HO	
1408	0 1	547(M+H)
	HO	
	O S NH.	
	NH ₂	

実施例	式	MS
番号 1409	9 V_H	529(M+H)
	HO NO	
	N NO ₂	
1410	0 H	435(M+H)
	HO N-CH ₃	
1411		504(M+H)
	HO	
1412	Q H	469(M+H)
~	HO	
1413	9	522(M+H)
	HO CI	
1414		488(M+H)
	HO N CI	
,		

	表147	B40
実施例	式	MS
実施例 番号 1415	HO HO CI	502(M+H)
1416	HO HO CI	488(M+H)
1417	HO N CI	502(M+H)
1418	HO N N	455(M+H)
1419	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	455(M+H)
1420	HO CI	522(M+H)

	表148	
実施例 番号	式	MS
1421	HO N	469(M+H)
1422		536(M+H)
1423	HO H ₃ C CH ₃	510(M+H)
1424	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	494(M+H)
1425	HONN	458(M+H)

実施例	武	MS
番号		
1426	HO N CI	612(M+H)
1427	OH OH	526(M+H)
1428	HO HO NO	480(M+H)
1429	HO	441(M+H)
1430	HO HO CH ₃	511(M+H)
	CH ₃	

	表150	
実施例	式	MS
番号 1431		530(M+H)
	HO	
1432	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	497(M+H)
1433	HO N	441(M+H)
1434	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	491(M+H)
1435	HO N	491(M+H)
1436	HO H	491(M+H)

実施例	表151 式	MS
番号	بامت	1010
1437	0, 11	524(M+H)
	N /	
	HO HO	1 1
	N W	
) CI	
1438	O, 1	508(M+H)
	HO N	
	. cí	
	()	
4.400		474(M+H)
1439	9	4/4(10/+/-1)
	HO	
	N V	
1440	O, H	490(M+H)
	HO	
1441	, O H	508(M+H)
1441	n	
	N N	
	HO CI	
	ČI	
	<u></u>	ATAMATIN
1442	Q H	474(M+H)
	HO	
	CI	
,		
		<u> L</u>

	表152	
実施例 番号	式	MS
1443	HO NO	516(M+H)
1444	HO	
1445	HO N S CH ₃	504(M+H)
1446	HO N O-CH ₃	534(M+H)
1447	HO	475(M+H)

	表153	MS
実施例	式	IVIS
番号		500(14:10)
1448	HO	530(M+H)
1449	0	440(M+H)
	HO	
1450	Q	490(M+H).
	HO	
1451	Q	474(M+H)
	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	
1452	Q	441(M+H)
	HO	
1453	0	508(M+H)
	HO N CI	

3/000234	表154	
実施例 番号	式	MS
1454	HO N	455(M+H)
1455	HO Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z	522(M+H)
1456	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	496(M+H)
1457	HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	516(M+H)
1458	HON	426(M+H)
1459	HO CH ₃ H ₃ C CH ₃	482(M+H)

₹	22
12 1	22

+H)
+H)
i+H)
(+ FT)
1+H)
1111
/I+H)
Л+Н)
Л+H)
Л+H)
/i+H)
Л+H)
/I+H)
Л+H)
Л+H) И+H)

	表156	
実施例	式	MS
番号 1466	CI CI	586(M+H)
	HO	540(04111)
1467	HO N	518(M+H)
1468	HO N	530(M+H)
1469	HO N N CI	598(M+H)
1470	но	512(M+H)
1471	HO N	544(M+H)

PCT/JP02/06405

13/000254	表158	
実施例 番号	式	MS
1478	HO CI	522(M+H)
1479	HO H ₃ C CH ₃	496(M+H)
1480	но	516(M+H)
1481	HO	426(M+H)
1482	H ₃ C CH ₃ CH ₃	482(M+H)

丰	1	50
75	- 1	ບອ

	表159	
実施例 番号	式	MS
1483	HO CH ₃	486(M+H)
1484	HO N	516(M+H)
1485	HO	427(M+H)
1486	HO	476(M+H)

	表160	MS
実施例	式	1010
番号	<u>,</u> Cl	460(M+H)
1487		
	<u></u>	
	QN	
	HO	
)	500(41.11)
1488		502(M+H)
	N N N	
	но	
	N	
1489		586(M+H)
	_\>	
1	HO CI	
1490		518(M+H)
	√) — Q	
	HO	

		表161	
実	施例	式	MS
	5号		530(M+H)
1	491		
		HO	
			E08(MITH)
	1492	. CI—	598(M+H)
		HO CI	
			512(M+H)
	1493		312(18111)
		HO NOH	
			54404:10
	1494		544(M+H)
		HON	

	表162	
実施例	式	MS
番号		
1495	0 	580(M+H)
	HO	
	N N-O	
1	N CH ₃	
)	
	Cl'	
1496	0	550(M+H)
	H	, ,
ł	но	
	N N	
	\ <u></u>	
	ci [/]	j
1497		606(M+H)
1497		OUG(IVITH)
]	HO	1
	CH ₃	
	H ₃ ¢ CH ₃	
	(_)	
	CI	
1498	O-CH3	580(M+H)
	()	
	HO	
	CI CI	
4400	7	EED/ATCAN
1499		550(M+H)
	\ <u>\</u> \	
	HO	
	CI	

	表163	MS
実施例 番号	式	10.00
1500	H₃C	606(M+H)
	CH ₃ CH ₃	
	HO	
	. ()	
4504		630(M+H)
1501	O N (S)	
	HO	
	CH ₃	
	J-F	
	F	600(M+H)
1502		
	HO	
	N N	
	F	
	F	OF CAME IN
1503	0	656(M+H)
	HO CH ₃	
	N N	
	H ₃ C CH ₃	
	~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~	
	F	

表164 MS 式 実施例 番号 630(M+H) O-CH3 1504 600(M+H) 1505 656(M+H) 1506 ӉӡҀ -CH₃ 580(M+H) 1507

	表105	MS
実施例	式	IVIO
番号		550(M+H)
1508	- II	
	но	
	CI	
1509		606(M+H)
1509		
	HO CH ₃	
	$N \sim N \sim$	
	H ₃ C CH ₃	
	CI	
1510	,O-CH ₃	580(M+H)
	\\>	
1		
	\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	,
	HO	
1	N N	
4544		550(M+H)
1511		
	, N CI	
	но	
		EACOMIN
1512	0	546(M+H)
	HON	
	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	
	CH ₃	
	_\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	

表1	66
----	----

	双100	MS
実施例	式	IVIO
番号		516(M+H)
1513	0	J 10(W111)
	но	
	N N N	
		570(M) (-1)
1514	O II	572(M+H)
Ì		
	HO CH ₃	
	N N N	
	H ₃ C CH ₃	
1515	_O—CH₃	546(M+H)
	()	
1)	
	N /	
	HO	
	. ()	
1516		516(M+H)
,0,0		
	N A	
	HO	
	N N	
1517	H ₃ C ₍	572(M+H)
1 '5''	CH ₃	
	CH ₃	
	√	1
	>	
	HO	
	N W	
		ļ
		1

実施例		MS
番号		
1518	0	602(M+H)
	HO	
		1
	CH ₃	
	CH ₃	
	. H₃C CH₃ H₃C	
	Π ₃ Ο	
1519	0	572(M+H)
	HO	
	<u>_</u> >	
	H ₃ C — CH ₃	
	H ₃ C — CH ₃ H ₃ C	
1520	0	628(M+H)
	HO CH ₃	
	$\sim \sim $	
	H³C, CH³	
	\ <u>_</u>	
	H ₃ C CH ₃	
	H ₃ C	
1521	0	606(M+H)
	HO CI	
V		
	H ₃ C CH ₃ H ₃ C	

	表168	T MC
実施例	式	MS
番号 1522	0	573(M+H)
1022		
	HO	
	N N	
	H ₃ C CH ₃ H ₃ C	
	113	
1523	0	606(M+H)
	HO	
	N N CI	
	H ₃ C CH ₃	
	H ₃ C CH ₃	
1524	O—;CH³	602(M+H)
	O CH ₃	
	HO HO CH.	
	H ₃ C CH ₃	
4505		572(M+H)
1525		
	CH ₃	
	HO H ₃ C CH ₃	

	表169	140
実施例 番号	式	MS
1526	H ₃ C CH ₃ CH ₃ CH ₃	628(M+H)
1527	HO CH ₃	606(M+H)
1528	HO N CH ₃ H ₃ C CH ₃	606(M+H)
1529	HO N CH ₃	614(M+H)

中华河		1 10
実施例 番号	式	MS
1530	0	584(M+H)
	но	
	N N	
	F F	
4504	f F	04004115
1531		640(M+H)
	HO CH ₃	
	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	
	H ₃ C CH ₃	
	F.	
	FF	
1532	9	618(M+H)
	\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	, ,
	НО	
	N CI	
	F	
}		
	É F	
1533	O-CH ₃	614(M+H)
		*
!	> /	
	F F	
	HO	
	N V	
1534		584(M+H)
	> -/	
	F N	
	HO	
	, M	
3		
,		
L	7	

表171 MS 式 実施例 番号 640(M+H) 1535 H₃C CH₃ 627(M+H) 1536 627(M+H) 1537

000254	表172	
実施例 番号	式	MS
1538	HO HO O	560(M+H)
1539	H ₃ C-O NO ₂ HN O HN O	634(M+H)
1540	HO NO CI	593(M+H)
1541	HO HO CI	627(M+H)

	表173	
実施例 番号	式	MS
1542	HO H	627(M+H)
1543	HO N	560(M+H)
1544	HO CH ₃	634(M+H)
1545	HO N N CI	593(M+H)

	表174	
実施例 番号	式	MS
1546	HO N N CI	627(M+H)
1547	HO PER	627(M+H)
1548	HO N N	560(M+H)
1549	HO NO ₂ O-CH ₃	634(M+H)

表175 MS 式 実施例 番号 627(M+H) 1550 560(M+H) 1551 532(M+H) 1552 565(M+H) 1553

	表176	
実施例 番号	式	MS
1554		599(M+H)
1555	HO HO	599(M+H)
1556	HO N N	532(M+H)
1557	HO N	532(M+H)

実施例 番号	式	MS
1558	HO N H	584(M+H)
1559	HO N H	570(M+H)

WO 03/000254 PCT/JP02/06405

表178

実施例	HCVポリメラーゼ	実施例	HCVポリメラーゼ
番号	阻害活性 I C ₅₀ [μM]	番号	阻害活性 I C _{5 0} [μM]
2	0. 079	67	0. 26
6	0. 034	68	0.28
9	0. 019	70	0. 19
11	0.53	71	0. 62
12	0.60	77	0. 51
17	0. 047	81	0. 18
20	0. 042	82	0. 097
26	0. 033	83	0. 52
30	0. 052	85	0. 17
43	0. 58	86	0. 13
44	0. 95	87	0.80
45	0. 40	88	0. 092
46	0. 47	89	0. 34
47	0.54	90	0.20
48	0. 44	91	0. 53
49	0.94	93	0. 16
50	0. 54	94	0.084
51	1.0	96	0. 25
54	0. 56	97	0. 16
55	0.36	98	0. 30

表179

実施例	HCVポリメラーゼ	実施例	HCVポリメラーゼ
番号	阻害活性 I C 5 0 [μM]	番号	阻害活性 I C 5 ο [μM]
99	0. 53	120	0.16
100	0. 78	121	0. 19
101	0. 14	122	0. 51
103	0. 17	123	0. 10
104	0.073	124	0.091
105	0. 076	125	0. 12
106	0.40	128	0. 14
107	0. 11	129	0. 12
108	0. 21	130	0. 16
109	0. 11	131	0.046
110	0. 24	132	0.055
111	0. 14	133	0. 12
112	0. 11	134	0.071
113	0. 071	139	0. 26
114	0. 56	140	0. 11
115	0. 17	141	0.43
116	0.37	142	0. 055
117	0. 075	143	0. 053
118	0.14	144	0. 19
119	0. 13	145	0. 088

表180

実施例	HCVポリメラーゼ	実施例	HCVポリメラーゼ
番号	阻害活性 I C 5 ο [μM]	番号	阻害活性 I C 50 [μM]
146	0.043	167	0.033
147	0. 31	168	0. 078
148	0. 038	169	0. 15
149	0. 15	170	0.048
150	0. 24	171	0. 050
151	0. 20	172	0. 10
153	0. 19	173	0. 14
154	0. 076	174	0. 030
155	0.53	175	0. 29
[156	0. 23	176	0. 053
157	0. 16	177	0.077
158	0. 11	178	0. 052
159	0. 13	179	0. 63
160	0.24	180	0. 11
161	0. 062	181	0. 71
162	0. 43	182	0. 021
163	0. 15	183	0. 017
164	0.16	184	0.018
165	0. 58	185	0. 11
166	0. 055	186	0. 37

表181

実施例	HCVポリメラーゼ	実施例	HCVポリメラーゼ
番号	阻害活性 I C ₅₀ [μM]	番号	阻害活性 I C ₅₀ [μM]
187	0.056	207	0. 081
188	0. 038	208	0. 039
189	0.017	209	0. 12
190	0.020	210	0. 31
191	0. 43	211	. 0, 059
192	0. 22	212	0. 23
193	0. 13	213	0. 10
194	0. 52	214	0. 059
195	0. 023	215	0. 078
196	0. 20	216	0. 084
197	0.11	217	0. 058
198	0. 044	218	0. 033
199	0. 11	219	0. 13
200	0. 10	220	0. 073
201	0. 14	221	0. 058
202	0. 095	222	0. 041
203	0. 063	223	0. 21
204	0. 16	225	0. 014
205	0. 077	227	0.045
206	0. 05	228	0. 18

表182

実施例	HCVポリメラーゼ	実施例	HCVポリメラーゼ
番号	阻害活性 I C ₅₀ [μM]	番号	阻害活性 I C _{5 0} [μM]
229	0. 022	257	0.074
230	0.17	259	0. 10
231	0. 073	260	0. 27
232	0. 015	262	0.013
233	0.028	263	0. 035
234	0. 022	264	<0.01
235	0. 036	265	0.014
236	0.075	266	0.018
237	0.015	267	0.014
238	0. 19	268	0.012
239	0. 17	269	0. 013
240	0. 055	270	0. 012
248	0.012	271	0. 024
249	0. 022	272	0.066
. 250	0.018	273	0.041
252	0. 32	276	0. 023
253	0. 65	279	0. 017
254	0.038	280	0.016
255	0.038	281	0. 052
256	0.079	282	0.019

表183

実施例	HCVポリメラーゼ	実施例	HCVポリメラーゼ
番号	阻害活性 I C _{5 0} [μM]	番号	阻害活性 I C _{5 0} [μM]
283	0.014	300	0. 045
284	0.014	301	0. 017
285	0.012	303	0. 10
286	0.014	304	0. 017
287	0.012	305	0. 01
288	0.013	306	0. 013
289	<0.01	307	0.022
290	0. 012	308	0. 023
291	0.016	311	0. 16
292	0. 015	312	0.023
293	0.034	313	0. 025
294	0. 032	314	0. 097
295	0.045	315	0.028
296	0.034	316	0. 022
297	0. 022	317	0. 032
298	0.011	318	0.012
299 .	0.018	319	0.030

表184

実施例	HCVポリメラーゼ	実施例	HCVポリメラーゼ
番号	阻害活性 I C _{5 0} [μM]	番号	阻害活性 I C _{5 0} [μM]
320	0. 036	328	0.015
321	0.015	329	0.047
322	0.016	330	0.011
323	0.018	331	0.017
324	0. 027	332	0. 023
325	0.019	333	0.016
326	0.018	334	0.016
327	0.019	335	0.013

表 185

実施例番号	249	1H NMR(δ) ppm
HOLLY	CI O S-H O	300MHz, DMSO-d6 8. 02 (1H, d, J=1.5Hz), 8. 11 (1H, d, J=1.8Hz), 7. 96-7. 81 (3H, m), 7. 67 (1H, s), 7. 61-7. 49 (6H, m), 7. 08 (2H, d, J=8.6 Hz), 5. 19 (2H, s), 4. 25 (1H, m), 2. 38-2. 17 (2H, m), 1. 96-1 . 78 (4H, m), 1. 70-1. 56 (1H, m), 1. 46-1. 16 (3H, m), 1. 11 (9 H, s)
純度 >	90% (NMR)	
MS	672 (M+1)	

実施例番号		250	1H NMR(δ) ppm
HOHO	O F F F N N N	CI -0 0=S-NH ₂ 0	300MHz, DMSO-d6 8. 25 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 16- 8. 08 (2H, m), 7. 99-7. 88 (2H, m), 7. 66 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 60-7. 48 (5H, m), 7. 19 (2H, d, J=8. 6Hz), 5. 17 (2H, s), 4. 31 (1H, m), 2. 39-2. 20 (2H, m), 2 .04-1. 79 (4H, m), 1. 72-1. 60 (1H, m), 1. 50-1. 18 (3H, m)
純度	> 9 0 %	(NMR)	
MS	616	(M+1)	

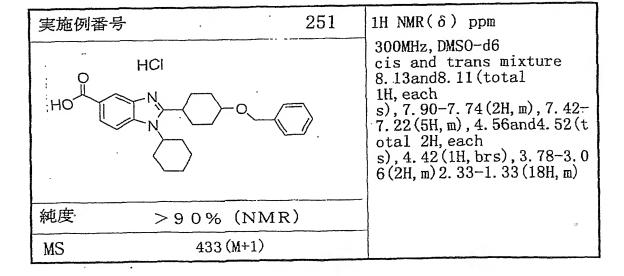
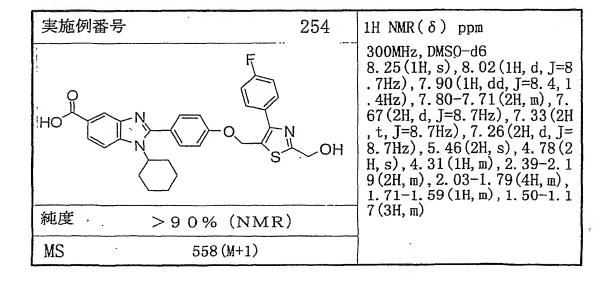


表 186

実施例番号	<u>1</u> 7	252	1H NMR(δ) ppm
:HO :			300MHz, DMSO-d6 8. 20 (1H, d, J=1.5Hz), 7.96 (1H, d, J=8.6Hz), 7.84 (1H, dd , J=8.6, 1.5Hz), 7.54 (2H, d, J=6.9Hz), 7.48-7.26 (8H, m) , 7.09 (1H, t, J=7.3Hz), 5.43 (2H, s), 4.06 (1H, m), 2.40-2 .20 (2H, m), 2.01-1.80 (4H, m), 1.75-1.64 (1H, m), 1.51-1 .28 (3H, m)
純度	> 9 0 % (NMR)	
MS	509 (M	+1)	

実施例番号	-	253	1H NMR(δ) ppm
НО			300MHz, DMSO-d6 8. 21 (1H, d, J=1. 5Hz), 7. 93 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 85 (1H, dd , J=8. 4, 1. 5Hz), 7. 54-7. 47 (2H, m), 7. 40-7. 24 (6H, m), 7. 15 (1H, d, J=3. 6Hz), 7. 11-7. 05 (1H, m), 6. 81 (1H, d, J=3. 6 Hz), 5. 26 (2H, s), 4. 96 (1H, m), 2. 32-2. 13 (2H, m), 1. 95-1 . 72 (4H, m), 1. 68-1, 55 (1H, m
純度	>90% (NMR)), 1. 43-1. 18 (3H, m)
MS	493 (M+1)		



実施例番号 25	5 1H NMR(δ) ppm
HCI OH N	300MHz, DMSO-d6 8. 34(1H, s), 8. 32(1H, d, J=8 .8Hz), 8. 09-8. 03(3H, m), 7. 83(2H, d, J=8. 3Hz), 7. 79(2H ,d, J=8. 8Hz), 7. 36(2H, d, J= 8. 8Hz), 5. 54(2H, s), 4. 38(1 H, m), 2. 74(3H, s), 2. 40-2. 1 8(2H, m), 2. 13-1. 96(2H, m), 1. 93-1. 78(2H, m), 1. 73-1. 5 7(1H, m), 1. 55-1. 15(3H, m)
純度 >90% (NMR)	
MS 568 (M+1)	

実施例番号	256	1H NMR(δ) ppm
HO	F O F	300MHz, DMSO-d6 12. 67 (1H, brs), 8. 23 (1H, s) , 7. 94and7. 87 (2H, ABq, J=8. 6Hz), 7. 79 (1H, dd, J=8. 7, 5. 4Hz), 7. 62-7. 41 (7H, m), 6. 8 0 (1H, dd, J=11. 9, 2. 3Hz), 6. 69 (1H, dd, J=8. 1, 2. 1Hz), 5. 20 (2H, s), 3. 93 (1H, brt, J=1 5. 3Hz), 2. 30-2. 11 (2H, brm) 1. 88-1. 74 (4H, brm), 1. 64-1
純度	>90% (NMR)].58(1H,brm),1.41-1.14(3H],brm)
MS	585 (M+1)	

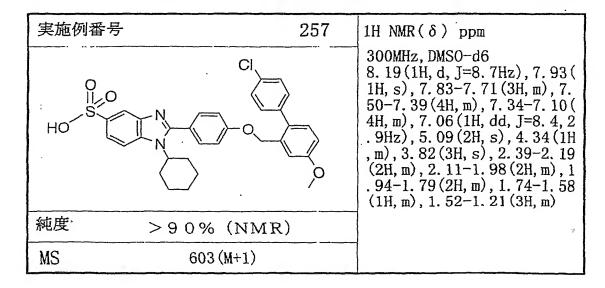
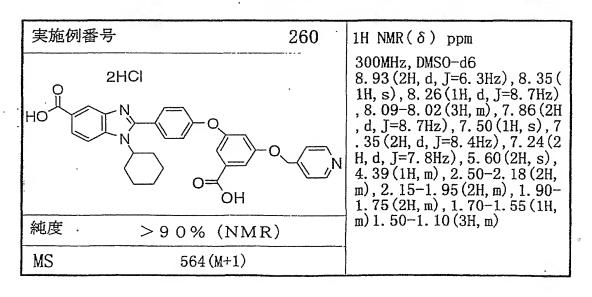


表 188

実施例番号	258	1H NMR(δ) ppm
CI N HOO		300MHz, DMSO-d6 7. 79 (1H, d, J=6. 7Hz), 7. 56 (1H, d, J=7. 5Hz), 7. 49 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 42 (4H, s), 7. 32 -7. 23 (3H, m), 7. 09-7. 03 (3H, m), 5. 02 (2H, s), 4. 46 (1H, m), 3. 82 (3H, s), 1. 95-1. 83 (2H, m), 1. 75-1. 44 (5H, m), 1. 30-1. 10 (2H, m), 0. 89-0. 71 (1H, m)
純度 >90% (1	NMR)	
MS 567 (M+	-1)	

実施例番号	259	1H NMR(δ) ppm
2HCI O HO N		300MHz, DMSO-d6 8. 93 (2H, d, J=6. 6Hz), 8. 36 (1H, s), 8. 28 (1H, d, J=8. 7Hz), 8. 10-8. 03 (3H, m), 7. 85 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 33 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 23 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 6. 81 (1H, s), 5. 56 (2H, s), 4. 39 (1H, m), 2. 97, 2. 92 (6H, s), 2. 40-2. 18 (2H, m), 2. 16-1. 95 (2H, m), 1. 90-1. 75 (
純度 > 9	0% (NMR)	2H, m), 1.70-1.55(1H, m), 1. 50-1.15(3H, m)
MS	591 (M+1)	



実施的	列番号	261	1H NMR(
	O CI CI		300MHz, 8. 22 (1H 1H, d, J= J=9. 0H) 7. 29 (1H 1H, d, J= J=9. 0Hz 6, 3. 0Hz -4. 25 (1
純度	>90% (1	IMR)	(4H, m), .50-1.1
MS	567 (M+	1)	

1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8. 22(1H, d, J=7.8Hz), 7.85(1H, d, J=6.7Hz), 7.63(2H, d, J=9.0H), 7.51-7.38(5H, m), 7.29(1H, d, J=8.3Hz), 7.23(1H, d, J=3.0Hz), 7.06(2H, d, J=9.0Hz), 7.06(1H, dd, J=8.6, 3.0Hz), 5.05(2H, s), 4.41-4.25(1H, m), 3.83(3H, s), 2.40-2.20(2H, m), 2.03-1.78(4H, m), 1.72-1.57(1H, m), 1.50-1.18(3H, m)

実施例	1番号 262
HO	CI N HCI NH ₂
純度	>90% (NMR)
MS	580 (M+1)

1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8. 29 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 26 (1H, d, J=9. 0Hz), 8. 19 (1H, d, J=1. 8Hz), 8. 13 (1H, brs), 8. 08-7. 96 (2H, m), 7. 73 (2H, d, J=9. 0Hz), 7. 57-7. 43 (6H, m), 7. 24 (2H, d, J=9. 0Hz), 5. 14 (2H, s), 4. 36 (1H, m), 2. 38-2 .18 (2H, m), 2. 12-1. 97 (2H, m), 1. 93-1. 80 (2H, m), 1. 73-1 .58 (1H, m), 1. 52-1. 20 (3H, m))

実施例番号		263
но	HO-0	N N
純度	>90% (NM)	R)
MS	548 (M+1)	

1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12. 85 (1H, brs), 8. 72 (1H, d, J=4. 8Hz), 8. 22 (1H, s), 8. 14 (1H, d, J=6. 3Hz), 8. 03and7. 76 (4H, ABq, J=8. 6Hz), 7. 93a nd7. 85 (2H, A'B'q, J=8. 6Hz), 7. 60and7. 15 (4H, A''B''q, J=8. 7Hz), 7. 55 (1H, dd, J=6. 3, 4. 8Hz), 5. 19 (2H, s), 4. 26 (1H, brt, J=12. 6Hz), 2. 35-2. 18 (2H, brm), 1. 95-1. 77 (4H, brm), 1. 70-1. 60 (1H, brm), 1. 45-1. 15 (3H, brm)

表 190

実施例番号		264	1H NMR(δ) ppm
:HO	CI N N		300MHz, DMSO-d6 8. 23(1H, d, J=1.0Hz), 7. 92(1H, dd, J=8.7, 1.0Hz), 7. 87(1H, d, J=8.7Hz), 7. 60(2H, d, J=8.6Hz), 7. 47(2H, d, J=8.7Hz), 7. 44(2H, d, J=8.7Hz), 7. 30(1H, d, J=8.3Hz), 7. 23(1H, d, J=2.6Hz), 7. 11(2H, d, J=8.7Hz), 7. 06(1H, dd, J=8.7Hz), 7. 06(1H, dd, J=8.7Hz), 5. 04(2H, s), 4. 36(1H, dd, S=8.7Hz), 7. 06(1H, dd, S=8.7Hz), 7.
純度	>90% (NMR))	1H, m), 3. 83 (3H, s), 2. 80-2. 70 (4H, m), 2. 60-2. 40 (2H, m)
MS	586, 588 (M+1)		, 2. 30-2. 20 (2H, m)

実施例番号 265	1H NMR(δ) ppm
HO N HCI ON	300MHz, DMSO-d6 8. 30 (1H, d, J=1.5Hz), 8. 25 (1H, d, J=9.1Hz), 8. 03 (1H, dd , J=8.7, 1.5Hz), 7. 76-7. 96 (3H, m), 7. 55-7. 49 (5H, m), 7. 42 (1H, d, J=7.6Hz), 7. 23 (2H , d, J=8. 7Hz), 5. 15 (2H, s), 4 . 35 (1H, m), 3. 01 (3H, s), 2. 9 7 (3H, s), 2. 37-2. 20 (2H, m), 2. 09-1. 97 (2H, m), 1. 94-1. 8
純度 >90% (NMR)	1 (2H, m), 1.72-1.60 (1H, m), 1.50-1.21 (3H, m)
MS 608 (M+1)	

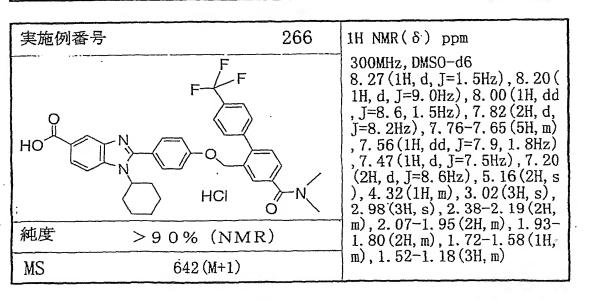
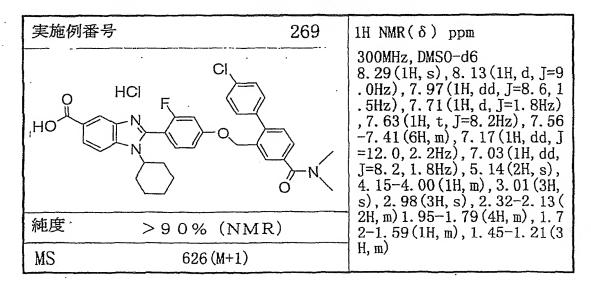


表 191

実施例番号	26	7	1H NMR(δ) ppm
НО	S N HCI O	N	300MHz, DMSO-d6 8.34(2H, m), 8.03(1H, d, J=8 .3Hz), 7.77-7.68(3H, m), 7. 54-7.40(4H, m), 7.33(2H, d, J=8.6Hz), 7.24(2H, d, J=9.0 Hz), 5.16(2H, s), 4.36(1H, m), 3.01(3H, s), 2.97(3H, s), 2.40-2.20(2H, m), 2.11-1.9 7(2H, m), 1.93-1.81(2H, m), 1.71-1.60(1H, m), 1.50-1.2
純度	>90% (NMR)		1 (3H, m)
MS	620 (M+1)		

実施例番号	268	1H NMR(δ) ppm
HCI F	O HX O	300MHz, DMSO-d6 8.67-8.59(1H, m), 8.30(1H, s), 8.13-8.20(2H, m), 8.02- 7.92(2H, m), 7.65(1H, t, J=8 .3Hz), 7.56-7.45(5H, m), 7. 18(1H, dd, J=12.0, 2.2Hz), 7 .05(1H, dd, J=8.6, 2.2Hz), 5 .14(2H, s), 4.09(1H, m), 2.8 2(3H, d, J=4.5Hz), 2.34-2.1 2(2H, m), 1.99-1.79(4H, m),
純度 >90%	(NMR)	1.71-1.59(1H, m), 1.49-1.2 1(3H, m)
MS 612 (M+1)	



実施例番号 270	1H NMR(δ) ppm
HCI CI HO NH ₂	300MHz, DMSO-d6 8. 24(1H, d, J=1.4Hz), 8. 19(1H, d, J=1.8Hz), 8. 11(1H, brs), 8. 02-7.85(3H, m), 7. 60-7.44(7H, m), 7. 10(1H, dd, J=12.0, 2.1Hz), 6. 98(1H, dd, J=8.4, 2.1Hz), 5. 11(2H, s), 3. 98(1H, m), 2. 30-2.12(2H, m), 1. 91-1.73(4H, m), 1. 71-1.58(1H, m), 1. 45-1.15(3H, m)
純度 > 90% (NMR)	
MS 598 (M+1)	

実施例番号	271	1H NMR(δ) ppm
HO HCI		300MHz, DMSO-d6 8. 29 (1H, d, J=1.5Hz), 8. 24 (1H, d, J=8.7Hz), 8. 07-7.98 (3H, m), 7. 80-7. 68 (5H, m), 7. 56 (1H, dd, J=8.0, 1.8Hz), 7. 47 (1H, d, J=8.0Hz), 7. 21 (2H, d, J=8.4Hz), 5. 18 (2H, s), 4. 34 (1H, m), 3. 27 (3H, s), 3. 0 2 (3H, s), 2. 98 (3H, s), 2. 38- 2. 18 (2H, m), 2. 10-1.95 (2H, s), 4.
純度 > 9	0% (NMR)	m), 1.93-1.79(2H, m), 1.72- 1.59(1H, m), 1.50-1.19(3H,
MS .	652 (M+1)	m)

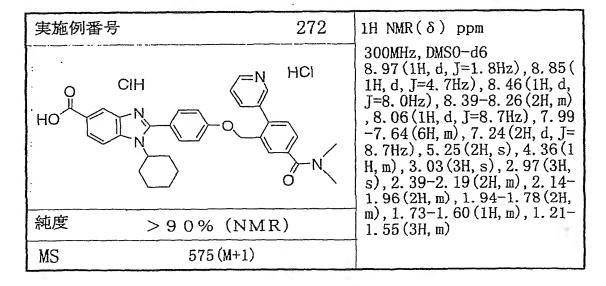


表 193

実施例番号	2	273	1H NMR(δ) ppm
HOTA	N-O N-O	-N(:	300MHz, DMSO-d6 8. 30 (1H, s), 8. 27 (1H, d, J=8 .7Hz), 8. 05 (1H, d, J=8. 7Hz) ,7. 77-7. 67 (3H, m). 7. 58-7. 48 (6H, m), 7. 22 (2H, d, J=8. 4 Hz), 5. 18 (2H, s), 4. 35 (1H, b rt, J=9. 8Hz), 3. 06-2. 88 (12 H, brm), 2. 38-2. 20 (2H, brm) ,2. 08-1. 96 (2H, brm), 1. 90- 1. 80 (2H, brm), 1. 70-1. 60 (1
純度	>90% (NMR)		H, brm), 1.49-1.22(3H, brm)
MS	645 (M+1)		

実施例番号		2	74	1H NMR(δ) ppm
HO HO		CI	, O	300MHz, DMSO-d6 mixture of cis and trans 8.35, 8.34(1H, s), 8.15-8.1 0(2H, m), 7.79-7.70(3H, m), 7.49(2H, d, J=8.7Hz), 7.44(2H, d, J=8.7Hz), 7.31(1H, d, J=8.4Hz), 7.25-7.19(2H, m), 7.07(1H, d, J=8.5Hz), 5.08 (2H, s), 4.75(1H, m), 3.83(3 H, s), 3.70-1.90(8H, m)
純度	約80%	(NMR)		,
MS	601	(M+1)		·

実施例番号	275	1H NMR(δ) ppm
HO NO CI	——————————————————————————————————————	300MHz, DMSO-d6 8. 33 (1H, s), 8. 13 (1H, d, J=7 .5Hz), 7. 93 (1H, d, J=8. 8Hz) ,7. 74 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 49 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 44 (2H, d , J=8. 6Hz), 7. 31 (1H, d, J=8. 5Hz), 7. 25-7. 15 (3H, m), 7. 0 7 (1H, d, J=8. 5Hz), 5. 08 (2H, s), 4. 98 (1H, m), 3. 83 (3H, s) ,3. 65-3. 45 (2H, m), 3. 30-3.
純度 >90% (NM	MR)	10 (2H, m), 3. 00-2. 75 (2H, m), 2. 60-2. 30 (2H, m)
MS 617 (M+1)		

表 194

実施例番号		276	1H NMR(δ) ppm
но	CI N N N S		300MHz, DMSO-d6 8. 25(1H, s), 7. 93and7.87(2 H, ABq, J=9.1Hz), 7. 55(1H, t , J=8.6Hz), 7. 48and7. 42(4H , A'B'q, J=8.6Hz), 7. 31(1H, d, J=8.5Hz), 7. 24(1H, d, J=2 .6Hz), 7. 09-6. 95(3H, m), 5. 05(2H, s), 4. 11(1H, brt, J=1 4. 0Hz), 3. 84(3H, s), 2. 83-2 .67(4H, brm), 2. 50-2. 32(2H
純度	>90% (NMR)	, brm), 2.21-2.10(2H, brm)
MS	603 (M+1)		

実施例番号	277	1H NMR(δ) ppm
но	CI N N N N N N	300MHz, DMS0-d6 cis and trans mixture 8.28and8.24(total 1H, each s), 7.94-7.87(1H, m), 7.60- 7.41(5H, m), 7.31(1H, d, J=8 .5Hz), 7.23-7.21(1H, m), 7. 12-7.05(2H, m), 7.00-6.95(1H, m), 5.06and5.05(total 2H, each
純度	>90% (NMR)	s), 4. 47and4. 34 (total 1H, each
MS	619 (M+1)	brs), 3.83(3H,s), 3.12-1.7 6(8H,m)

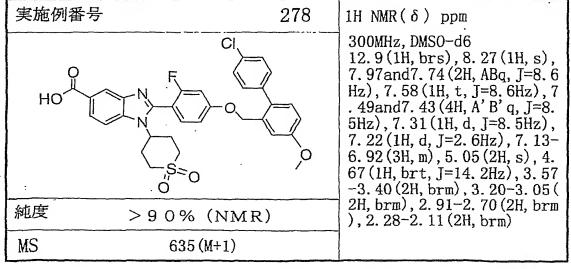


表 195

実施例番号	-	279	1H NMR(δ) ppm
но	HCI .		300MHz, DMSO-d6 8. 30 (1H, s), 8. 23 (1H, d, J=8 .7Hz), 8. 06-8. 00 (2H, m), 7. 83 (1H, dd, J=8. 0, 1. 8Hz), 7. 71 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 64 (1H ,d, J=8. 0Hz), 7. 59-7. 54 (4H ,m), 7. 22 (2H, d, J=8. 4Hz), 5 .25 (2H, s), 4. 33 (1H, m), 2. 6 6 (3H, s), 2. 66 (3H, s), 2. 37- 2. 19 (2H, m), 1. 93-1. 80 (2H,
純度	> 9 0 %	(NMR)	m), 1.70-1.59(1H, m), 1.47- 1.21(3H, m)
MS	644	(M+1)	

実施例番号	280	1H NMR(δ) ppm
HCI N	CI O O O O	300MHz, DMSO-d6 8. 32-8. 23 (3H, m), 8. 08-8. 0 1 (2H, m), 7. 73 (2H, d, J=8. 6H z), 7. 65 (1H, d, J=8. 2Hz), 7. 59-7. 51 (4H, m), 7. 25 (2H, d, J=8. 6Hz), 5. 21 (2H, s), 4. 34 (1H, m), 3. 32 (3H, s), 2. 37-2 .19 (2H, m), 2. 10-1. 98 (2H, m), 1. 93-1. 80 (2H, m), 1. 71-1 .60 (1H, m), 1. 51-1. 21 (3H, m
純度 >90%	(NMR)	,
MS . 61	5 (M+1)	

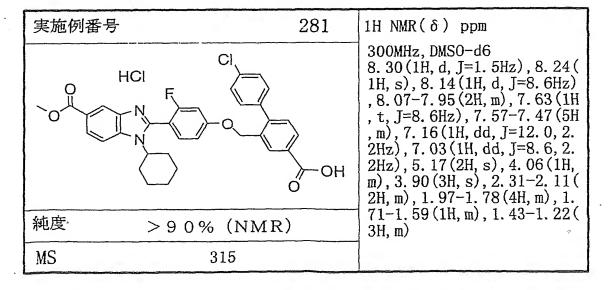


表 196

実施例番-	무	282	1H NMR(δ) ppm
HO	HCI CI	CIH	300MHz, DMSO-d6 8. 36 (1H, s), 8. 35 (1H, d, J=9 .3Hz), 8. 09 (1H, d, J=9. 3Hz) ,7. 78 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 48 -7. 25 (9H, m), 5. 09 (2H, s), 4 .39 (1H, m), 3. 04 (6H, s), 2. 4 0-2. 15 (2H, m), 2. 10-1. 95 (2 H, m), 1. 90-1. 75 (2H, m), 1. 7 0-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3 H, m)
純度	>90% (NM	R)	
MS	580 (M+1)		<u>.</u>

CONTRACTOR DESCRIPTION OF THE PROPERTY OF THE			
実施例番号		283	1H NMR(δ) ppm
НО	HCI CI		300MHz, DMSO-d6 10.03(1H, s), 8.33(1H, s), 8 .29(1H, d, J=8.7Hz), 8.06(1 H, d, J=9.0Hz), 7.74(2H, d, J =9.0Hz), 7.51-7.42(5H, m), 7.37-7.30(2H, m), 7.22(2H, d, J=8.7Hz), 5.10(2H, s), 4. 37(1H, m), 3.06(3H, s), 2.40 -2.18(2H, m), 2.15-1.95(2H, m), 1.90-1.80(2H, m), 1.75
純度	>90% (1	IMR)	-1.55(1H, m), 1.50-1.20(3H, m)
MS	630 (M+	1)	·

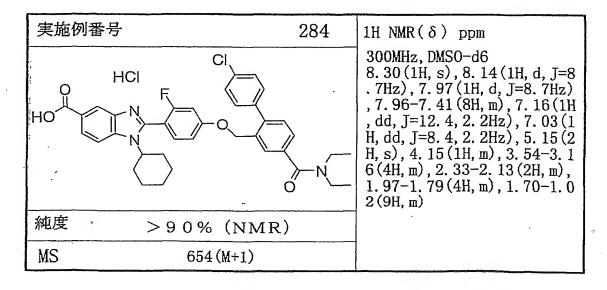


表 197

実施例番号		285	1H NMR(δ) ppm
НОНО	CI CI N N O	≽-¤ }-	300MHz, DMSO-d6 8. 37 (1H, d, J=7. 3Hz), 8. 30 (1H, s), 8. 19-8. 12 (2H, m), 8. 02-7. 95 (2H, m), 7. 65 (1H, t, J=8. 4Hz), 7. 56-7. 43 (5H, m) ,7. 18 (1H, dd, J=12. 0, 1. 8Hz), 7. 06 (1H, dd, J=8. 4, 2. 1Hz), 5. 13 (2H, s), 4. 22-4. 03 (2 H, m), 2. 34-2. 13 (2H, m), 1. 9 9-1. 78 (4H, m), 1. 72-1. 57 (1
純度	>90% (NMR)		H, m), 1.44-1.14(3H, m), 1.2 0, 1.18(6H, each s)
MS	640 (M+1)		

実施例番	<u> </u>	2	286	1H NMR(δ) ppm
но	HCI F N		N	300MHz, DMSO-d6 8. 29 (1H, s), 8. 13 (1H, d, J=8 .7Hz), 7. 97 (1H, dd, J=8. 7, 1 .4Hz), 7. 69-7. 40 (8H, m), 7. 16 (1H, dd, J=12. 0, 2. 2Hz), 7 .02 (1H, dd, J=8. 4, 2. 2Hz), 5 .15 (2H, s), 4. 07 (1H, m), 3. 7 1-3. 23 (2H, m), 1. 98-1. 71 (4 H, m), 1. 71-1. 18 (10H, m)
純度	> 9 0 %	(NMR)		
MS	666 (M+1)		

実施例番号 287	1H NMR(δ) ppm
HCI CI HCI N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	300MHz, DMSO-d6 8. 29 (1H, s), 8. 13 (1H, d, J=8 .0Hz), 7. 97 (1H, d, J=8. 4Hz) , 7. 83 (1H, s), 7. 68-7. 41 (7H , m), 7. 17 (1H, d, J=12. 0Hz), 7. 03 (1H, d, J=8. 4Hz), 5. 15 (2H, s), 4. 07 (1H, m), 3. 58-3. 41 (4H, m), 2. 34-2. 13 (2H, m) , 1. 97-1. 77 (8H, m), 1. 71-1. 58 (1H, m), 1. 49-1. 18 (3H, m)
純度 >90% (NMR)	
MS 652 (M+1)	

表 198

実施例番号		28	88	1H NMR(δ) ppm
HO	CI CI CI	H	ОН	300MHz, DMSO-d6 8. 62 (1N, m), 8. 31 (1H, s), 8. 22-8. 14 (2H, m), 8. 99 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 66 (1H, t, J=7. 7 Hz), 7. 58-7. 44 (5H, m), 7. 19 (1H, dd, J=8. 7, 2. 2Hz), 5. 14 (2H, s), 4. 11 (1H, m), 3. 67-3 .49 (2H, m), 3. 45-3. 30 (2H, m), 2. 37-2. 12 (2H, m), 2. 00-1 .76 (4H, m), 1. 70-1. 58 (1H, m
純度	> 9 0 %	(NMR)), 1. 48-1. 17 (3H, m)
MS	642	(M+1)		

実施例番号 289	1H NMR(δ) ppm
HCI F N N N N N N N N N N N N N N N N N N	400MHz, DMSO-d6 8. 28(1H, s), 8. 11(1H, d, J=8 .9Hz), 7. 96(1H, d, J=8. 9Hz) ,7. 68(1H, s), 7. 62(1H, t, J= 8. 2Hz), 7. 55-7. 41(6H, m), 7 .15(1H, d, J=11. 7Hz), 7. 02(1H, d, J=8. 4Hz), 5. 14(2H, s) ,4. 12-3. 13(6H, m), 2. 30-1. 19(13H, m)
純度 >90% (NMR)	
MS 682 (M+1)	

実施例番号	290	1H NMR(δ) ppm
HCI F O		400MHz, DMSO-d6 8. 29 (1H, s), 8. 15 (1H, d, J=8 .6Hz), 7. 98 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 72 (1H, s), 7. 64 (1H, t, J= 8. 8Hz), 7. 57-7. 43 (6H, m), 7 .18 (1H, dd, J=12. 1, 2. 1Hz), 7. 03 (1H, d, J=10. 7Hz), 5. 12 (2H, s), 4. 15-4. 01 (1H, m), 3 .75-3. 33 (8H, m), 2. 31-2. 14 (2H, m), 1. 96-1. 78 (4H, m), 1
純度 >90%	(NMR)	.70-1.58(1H, m), 1.47-1.21 (3H, m)
MS 668 ()	M+1)	·

表 199

実施例番	子号	291	1H NMR(δ) ppm
НО	HCI F O		400MHz, DMSO-d6 8. 29(1H, s), 8. 14(1H, d, J=8 .9Hz), 7. 97(1H, d, J=8. 6Hz) ,7. 71(1H, s), 7. 63(1H, t, J= 8. 2Hz), 7. 56-7. 42(6H, m), 7 .17(1H, d, J=12. 3Hz), 7. 03(1H, d, J=10. 7Hz), 5. 14(2H, s), 4. 07(1H, m), 3. 96-3. 52(4 H, m), 2. 79-2. 56(4H, m), 2. 3 2-2. 14(2H, m), 1. 97-1. 79(4
純度	> 90% (NM)	R)	Н, m), 1.71-1.58(1Н, m), 1.5 1-1.19(3Н, m)
MS	684 (M+1)		·

実施例番	号	2	92	1H NMR(δ) ppm
HO	HCI F O	H_O	ОН	300MHz, DMSO-d6 9.07-8.99(1H, m), 8.30(1H, s), 8.23-8.12(2H, m), 8.04-7.95(2H, m), 7.65(1H, t, J=8.2Hz), 7.60-7.45(5H, m), 7.19(1H, dd, J=12.0, 2.6Hz), 7.06(1H, dd, J=8.6, 2.2Hz), 5.16(2H, s), 4.18-4.02(1H, m), 3.97(2H, d, J=6.0Hz), 2.33-2.14(2H, m), 1.99-1.79(4
純度	> 9 0 %	(NMR)		H, m), 1.72-1.59(1H, m), 1.4 5-1.19(3H, m)
MS	656	(M+1)		

実施例番号 293	1H NMR(δ) ppm
HO N CI	300MHz, DMSO-d6:8. 21 (1H, s), 7. 94and7. 86 (2H, ABq, J=8 .6Hz), 7. 72 (1H, d, J=2. 4Hz), 7. 59and7. 11 (4H, A'B'q, J=8. 9Hz), 7. 53 (1H, dd, J=8. 4Hz), 7. 36and7. 32 (4H, A"B"q, J=8. 1Hz), 5. 07 (2H, s), 4. 27 (1H, brt, J=13. 8Hz), 2. 87 (2H, t, J=7. 8Hz), 2. 57 (2H, t
純度 >90% (NMR)	7.8Hz), 2.35-2.20(2H, brm), 1.96-1.79(4H, brm), 1.68-
MS 637 (M+1)	1.59(1H, brm), 1.47-1.18(3 H, brm)

表 200

実施例番号		294	1H NMR(δ) ppm
HO	HCI (CI	300MHz, DMSO-d6 8. 30 (1H, s), 8. 25and8. 03 (2 H, ABq, J=8. 9Hz), 7. 73 (1H, s), 7. 73 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 5 5 (1H, dd, J=8. 0, 2. 3Hz), 7. 4 0 (4H, s), 7. 39 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 23 (2H, d, J=8. 6Hz), 5. 11 (2H, s), 4. 55 (2H, s), 4. 36 (1H, brt, J=14. 8Hz), 2. 37-2 . 19 (2H, brm), 2. 09-1. 96 (2H
純度	>90% (NN	AR)	, brm), 1.91-1.79(2H, brm), 1.71-1.59(1H, brm), 1.50-1
MS	567 (M+1)		. 20 (3H, brm)

		,
実施例番号	295	1H NMR(δ) ppm
но	HCI O-	300MHz, DMSO-d6 8. 30(1H, s), 8. 25and8. 04(2 H, ABq, J=8. 7Hz), 7. 74(1H, s), 7. 72(2H, d, J=8. 7Hz), 7. 5 6(1H, d, J=8. 7Hz), 7. 48-7. 3 5(5H, m), 7. 22(2H, d, J=8. 7Hz), 5. 11(2H, s), 4. 46(2H, s), 4. 35(1H, brt, J=14. 8Hz), 3 .31(3H, s), 2. 37-2. 17(2H, brm), 2. 07-1. 95(2H, brm), 1.
純度	>90% (NMR)	92-1.79(2H, brm), 1.73-1.5 6(1H, brm), 1.52-1.20(3H, b
MS	581 (M+1)	rm)

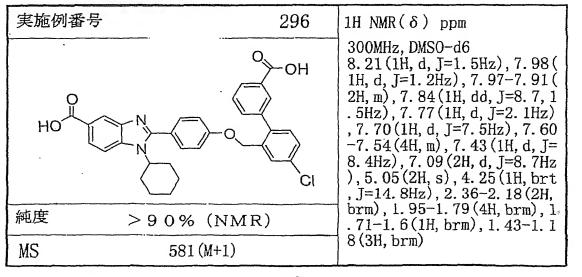


表 201

実施例番号 297	1H NMR(δ) ppm
HO CI	300MHz, DMSO-d6 12.7(1H, brs), 8.21(1H, s), 7.94and7.85(2H, ABq, J=8.6 Hz), 7.60-7.55(3H, m), 7.49 and7.45(4H, A'B'q, J=8.3Hz), 7.12(2H, d, J=8.7Hz), 5.0 5(2H, s), 4.26(1H, brt, J=13 .0Hz), 2.54(3H, s), 2.38-2. 20(2H, brm), 1.97-1.80(4H, brm), 1.71-1.59(1H, brm), 1
純度 >90% (NMR)	. 47-1. 20 (3H, brm)
MS 583 (M+1)	

実施例番号	298	1H NMR(δ) ppm
HONN	s=0	300MHz, DMSO-d6 8. 22(1H, s), 8. 01(1H, s), 7. 95and7. 86(2H, ABq, J=8. 6Hz), 7. 79(1H, d, J=7. 8Hz), 7. 5 8(3H, t, J=7. 5Hz), 7. 53(4H, s), 7. 13(2H, d, 8. 7Hz), 5. 15 (2H, s), 4. 26(1H, brt, J=13. 8Hz), 2. 83(3H, s), 2. 37-2. 1 8(2H, brm), 1. 95-1. 78(4H, brm), 1. 70-1. 59(1H, brm), 1.
純度 >90% (NMR)	47-1.17 (3H, brm)
MS 599 (M-	+1)	

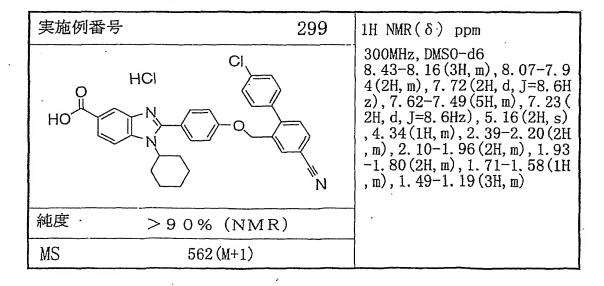


表 202

実施例番	号	300	1H NMR(δ)
HO	F, C	· N	300MHz, DMSC rs), 8.83 (2H .56 (2H, dd, J .22 (1H, d, J= H, dt, J=7.9, H, d, J=8.6Hz J=8.6, 1.5Hz =8.7Hz), 7.4 ,4.9Hz), 7.2 0,4.9Hz), 7.2
純度	>90% (NI	MR)	8, 2. 3Hz), 6. (1H, brt), 2.
MS	523 (M+1)		, 1.87-1.73

1H NMR(δ) ppm

300MHz, DMSO-d6:2.77(1H, b rs), 8.83(2H, d, J=1.9Hz), 8.56(2H, dd, J=4.9, 1.9Hz), 8.22(1H, d, J=1.5Hz), 7.97(2 H, dt, J=7.9, 1.9Hz), 7.95(1 H, d, J=8.6Hz), 7.87(1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.57(1H, t, J=8.7Hz), 7.46(2H, dd, J=7.9, 4.9Hz), 7.26(1H, dd, J=12.0, 4.9Hz), 7.14(1H, dd, J=8.8, 2.3Hz), 6.99(2H, s), 3.94(1H, brt), 2.26-2.09(2H, m), 1.87-1.73(4H, m), 1.67-1.57(1H, m), 1.42-1, 12(2H, m)

MS F	実施例番号		301
	но	F N O N	N-
MS 663 (M+1)	純度	>90% (N	MR)
	MS	663 (M+1	.)

1H NMR(δ) ·ppm

300MHz, DMSO-d6
8. 22(1H, s), 7. 95(1H, d, J=8
. 7Hz), 7. 87(1H, dd, J=1. 5Hz
, 9. 0Hz), 7. 62(4H, d, J=8. 4H
z), 7. 55(1H, t, J=9. 0Hz), 7.
44(4H, d, J=8. 1Hz), 7. 20(1H
, dd, J=2. 1Hz, 12. 0Hz), 7. 11
(1H, dd, J=2. 1Hz, 8. 7Hz), 6.
86(1H, s), 3. 94(1H, m), 2. 96
, 2. 88(12H, s), 2. 35-2. 00(2
H, m), 1. 95-1. 70(4H, m), 1. 6
5-1. 50(1H, m), 1. 45-1. 10(3
H, m)

Na ⁺ O Na Na Na Na Na Na Na Na Na N	١	実施例番号	302	1H NMR(δ) p
		O Na [†] O	F O S S	300MHz, DMSO- 8. 14 (1H, s), .4Hz), 7. 68 (,7. 64-7. 55 (,t, J=8. 7Hz), ,m), 7. 11 (1H, (2H, m), 3. 90 .00 (2H, m), 1), 1. 45-1. 00
MS 532 (M+1)		純度	>90% (NMR)	
		MS	532 (M+1)	

1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8. 14 (1H, s), 7. 88 (1H, d, J=8 .4Hz), 7. 68 (1H, d, J=8. 7Hz) , 7. 64-7. 55 (3H, m), 7. 50 (1H , t, J=8. 7Hz), 7. 22-7. 17 (3H , m), 7. 11 (1H, s), 7. 08-7. 00 (2H, m), 3. 90 (1H, m), 2. 15-2 .00 (2H, m), 1. 95-1. 50 (5H, m), 1. 45-1. 00 (3H, m)

表 203

実施	例番号	303	1H NMR(δ) ppm
0	O F N	CI	300MHz, CDC13 8. 49 (1H, s), 7. 98 (1H, dd, J= 8. 6, 1. 5Hz), 7. 71 (1H, d, J=1 .8Hz), 7. 66 (1H, d, J=8. 6Hz) , 7. 55-7. 29 (7H, m), 6. 80 (1H, dd, J=8. 2, 2. 2Hz), 6. 69 (1H, dd, J=11. 2, 2. 2Hz), 4. 99 (2 H, s), 4. 10-3. 92 (1H, m), 3. 9 5 (3H, s), 3. 15 (3H, s), 3. 06 (3H, s), 2. 31-2. 14 (2H, m), 2.
純度	> 9 0 %	(NMR)	04-1.86(4H, m), 1.81-1.71(1H, m), 1.41-1.21(3H, m)
MS	640	(M+1)	

実施例番号	30	04 1H NMR(δ) ppm
O'Na ⁺	CI	300MHz, DMSO-d6 8. 21 (1H, s), 7. 94 (1H, d, J=8 . 7Hz), 7. 84 (1H, d, J=9. 1Hz) , 7. 70 (1H, s), 7. 26-7. 39 (9H , m), 7. 11 (2H, d, J=8. 4Hz), 5 . 11 (2H, s), 4. 26 (1H, m), 3. 0 1 (3H, s), 2. 97 (3H, s), 2. 38- 2. 19 (2H, m), 1. 97-1. 78 (4H, m), 1. 72-1. 57 (1H, m), 1. 48- 1. 17 (3H, m)
純度 > 9	0% (NMR)	
MS	608 (M+1)	

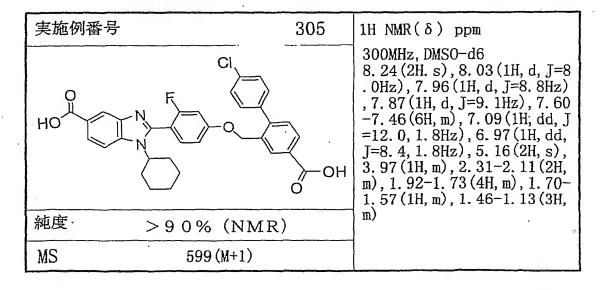
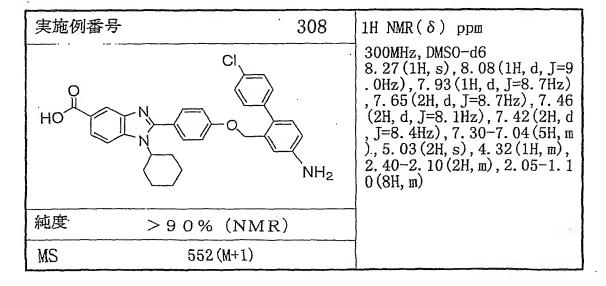


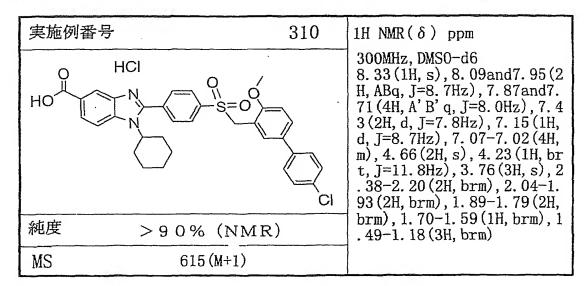
表 204

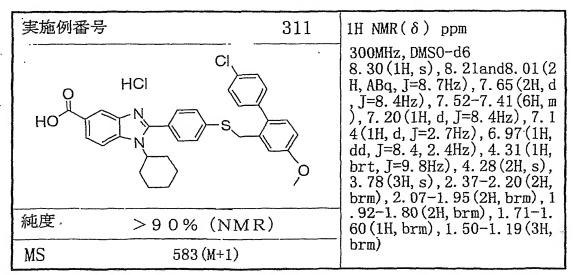
実施例番号	306	1H NMR(δ) ppm
HO-0 HO-0 HO-0		300MHz, DMSO-d6 12.84(1H, brs), 8.21(1H, s) ,7.98-7.84(5H, m), 7.58(2H, d, J=8.7Hz), 7.54(2H, d, J=7.8Hz), 7.34(1H, d, J=8.7Hz), 7.26(1H, d, J=2.4Hz), 7.13-7.06(3H, m), 5.06(2H, s) ,4.26(1H, brt, J=12.7Hz), 3 .84(3H, s), 2.36-2.17(2H, brm), 1.99-1.80(4H, brm), 1.
純度 > 9 ()% (NMR)	73-1.59(1H, brm), 1.47-1.1 7(3H, brm)
MS	577 (M+1)	

実施例番号	307	1H NMR(δ) ppm
H ₂ N	O N	300MHz, DMSO-d6 8. 22(1H, s), 8. 04(1H, s), 7. 96(2H, d, J=8. 1Hz), 7. 87(2H, s), 7. 72(1H, d, J=1. 2Hz), 7. .59-7. 41(7H, m), 5. 12(2H, s), 4. 25(1H, brt, J=11. 8Hz), 3. 02(3H, brs), 2. 98(3H, brs), 2. 38-2. 15(2H, brm), 1. 93 -1. 76(4H, brm), 1. 71-1. 59(1H, brm), 1. 46-1. 16(3H, brm)
純度 >90%	(NMR))
MS 617	(M+1)	



実施例番号	309	1H NMR(δ) ppm
O HCI	O O O	300MHz, DMSO-d6 8. 33 (1H, s), 8. 15and7. 99 (2 H, ABq, J=8. 9Hz), 7. 84and7. 59 (4H, A'B'q, J=8. 3Hz), 7. 4 6 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 22-7. 1 6 (3H, m), 7. 01-6. 98 (2H, m), 4. 27and4. 23 (2H, A"B"q, J=1 2. 9Hz), 3. 78 (3H, s), 2. 39-2 .21 (2H, brm), 2. 07-1. 95 (2H, brm), 1. 91-1. 80 (2H, brm),
純度 >90%	(NMR)	1.72-1.59(1H, brm), 1.49-1 .17(3H, brm)
MS		·





実施例番号 312	1H NMR(δ) ppm
HO N F OH OH	300MHz, DMSO-d6 8. 22 (1H, s), 8. 12 (1H, d, J=8 .4Hz), 8. 00-7. 84 (5H, m), 7. 70 (4H, d, J=8. 4Hz), 7. 56 (1H ,t, J=8. 6Hz), 7. 23 (1H, d, J= 12. 0Hz), 7. 13 (1H, d, J=8. 6H z), 6. 97 (1H, s), 3. 92 (1H, m) ,2. 35-2. 00 (2H, m), 1. 95-1. 70 (4H, m), 1. 65-1. 55 (1H, m) ,1. 50-1. 05 (3H, m)
純度 >90% (NMR)	
MS 609 (M+1)	

実施例番号	- 3	13	1H NMR(δ) ppm
НО	TN FO N		300MHz, DMSO-d6 8.89(1H, brs), 8.63(1H, brs), 8.24(1H, s), 8.11(1H, d, J=7.8Hz), 7.99(1H, d, J=8.8Hz), 7.89(1H, d, J=9.9Hz), 7.61-7.55(4H, m), 7.43(2H, t, J=7.7Hz), 7.34(1H, t, J=7.2Hz), 7.24(1H, d, J=12.0Hz), 7.14(1H, d, J=8.6Hz), 6.95(1H, s), 3.96(1H, m), 2.35-2.
純度	>90% (NMR)		05 (2H, m), 2.00-1.50 (5H, m), 1.45-1.10 (3H, m)
MS	522 (M+1)		

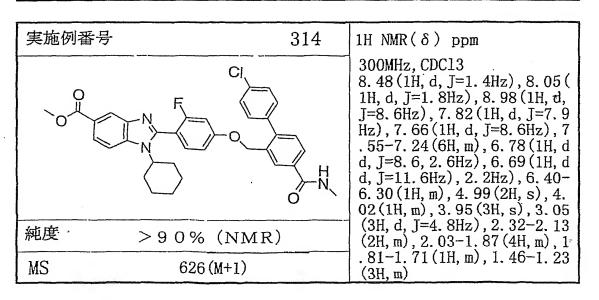
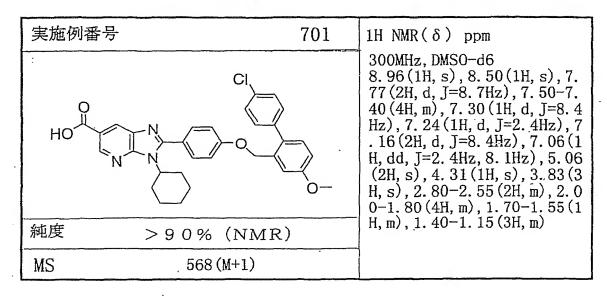


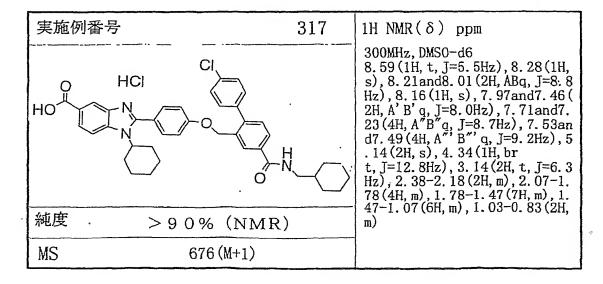
表 207

実施例番号 503	1H NMR(δ) ppm
HOLL	300MHz, DMSO-d6 8. 23 (1H, s), 7. 76 (1H, d, J=8 .7Hz), 7. 58 (1H, d, J=8. 8Hz) , 7. 51-7. 32 (7H, m), 7. 17 (2H , d, J=8. 7Hz), 6. 55 (1H, s), 5 .18 (2H, s), 4. 75 (1H, m), 2. 3 5-2. 12 (2H, m), 2. 10-1. 85 (4 H, m), 1. 80-1. 50 (2H, m)
純度 > 90% (NMR)	
MS 412 (M+1)	



実施例番号		315	1H NMR(δ) ppm
но	HCI -N	N= CI	300MHz, DMSO-d6 8.84(2II, d, J=6.3Hz), 8.28(1H, s), 8.17and7.99(2H, ABq, J=8.7Hz), 7.87-7.85(3H, m), 7.70 -7.50(3H, m), 7.52(1H, d, J=8.3Hz), 7.18(2H, d, J=8.7Hz), 5. 22(2H, s)4.31(1H, br t, J=12.5Hz), 2.36-2.18(2H, m), 2.03-1.78(4H, m), 1.70-1.5 8(1H, m), 1.50-1.23(3H, m)
純度	. > 9 0 %	(NMR)	
MS	538 (M+1)	

実施例番号		316	1H NMR(δ) ppm
HO	CI	H N	300MHz, DMSO-d6 9. 23 (1H, t, J=6. 3Hz), 8. 29 (1H, s), 8. 25-8. 22 (2H, m), 8. 03 (2H, d, J=7. 9Hz), 7. 55-7. 48 (5H, m) 7. 34 (4H, d, J=4. 4Hz), 7. 28-7. 22 (3H, m), 5. 15 (2H, s), 4. 52 (2H, d, J=5. 9Hz), 4. 35 (1H, br t, J=12. 1Hz), 2. 37-2. 18 (2H, m), 2. 08-1. 95 (2H, m), 1. 91-1. 79 (2H, m), 1. 72-1. 59 (1H, m), 1. 47-1. 19 (3H, m)
純度	> 9 0% (NMF	₹)	, m)
MS	670 (M+1)		



実施例番	号 31	8 1
НО	2HCI CI 2HCI N O H	
純度	>90% (NMR)	2
MS	. 671 (M+1)	

IH NMR(δ) ppm

300MHz, DMSO-d6 9.63 (1H, t, J=4.8Hz), 8.86and7.97 (
4H, ABq, J=6.6Hz), 8.30 (1H, s), 8.27 (1H, s), 8.23and8.03 (2H, A 'B'q, J=8.8Hz), 8.09and7.54 (2 H, A"B"q, J=8.1Hz), 7.73and7.2 4 (4H, A"'B"'q, J=8.8Hz), 7.54a nd7.52 (4H, A""B""q, J=8.8Hz), 5.16 (2H, s) 4.78 (2H, d, J=5.6Hz), 4.35 (1H, br t, J=11.0Hz), 2.39-2.19 (2H, m), 2.07-1.96 (2H, m), 1.91-1.78 (
2H, m), 1.70-1.57 (1H, m) 1.50-1 .19 (3H, m)

実施例番	号	319
НО	HCI CI	
純度	>90% (NMR)
MS	684 (M+1)	

1H NMR(δ) ppm

300MHz, DMSO-d6 8. 28(1H, s), 8. 24and8. 03(2H, A Bq, J=9. 0Hz), 7. 77(1H, s), 7. 70 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 64-7. 10(13 H, m), 5. 16(2H, s), 4. 74and4. 57 (total 2H, each br s), 4. 34(1H, br t, J=11. 7Hz), 2. 90(3H, s), 2. 35 -2. 17(2H, m), 2. 07-1. 93(2H, m), 1. 93-1. 78(2H, m), 1. 71-1. 57(1H, m), 1. 51-1. 19(3H, m)

実施例番号	320
но	2HCI N=
純度·	>90% (NMR)
MS	575 (M+1)

1H NMR(δ) ppm

300MHz, DMSO-d6 8.94and8.06 (4H, ABq, J=6.8Hz), 8.33 (1H, s), 8.28and8.05 (2H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.80 (1H, s), 7.73and7.22 (4H, A"B"q, J=8.7Hz), 7.63and7.57 (2H, A"'B"'q, J=7.9Hz), 5.30 (2H, s), 4.34 (1H, brt, J=12.1Hz), 3.04 (3H, s), 2.97 (3H, s), 2.38-2.18 (2H, m), 2.10 -1.96 (2H, m), 1.93-1.80 (2H, m), 1.72-1.58 (1H, m), 1.52-1.08 (3H, m)

実施例番号 321	1H NMR(δ) ppm
O 2HCI HO N O N N N N N N N N N N N N N N N N	300MHz, DMSO-d6 11. 19 (1H, br s), 8. 31 (1H, s), 8. 23and8. 02 (2 H, ABq, J=9. OHz), 7. 77 (1H, s), 7 .72and7. 23 (4H, A'B'q, J=8. 7Hz), 7. 59and7. 48 (2H, A'B''q, J=7. 9Hz), 7. 53and7. 51 (4H, A''' B'''q , J=9. OHz), 5. 16 (2H, s), 4. 72-2 .97 (8H, br m), 4. 34 (1H, br t, J=12. 1Hz), 2. 79 (3H, s), 2. 38 -2. 17 (2H, m), 2. 07-1. 93 (2H, m)
純度 >90% (NMR)	,1.93-1.78(2H,m),1.69-1.58(1H,m),1.50-1.10(3H,m)
MS 663 (M+1)	

実施例番号 :	322	1H NMR(δ) ppm
HO 2HCI CI HO N N N N N N N N N N N N N N N N N N		300MHz, DMSO-d6 9.54(1H, t, J=5.7Hz), 8.91(1H, s), 8.81(1H, d, J=4.9Hz), 8.48(1H, d, J=7.9Hz), 8.32(1H, s), 8. 27(1H, d, J=9.0Hz), 8.25(1H, s), 8.07-7.97(3H, m), 7.74and7.2 5(4H, ABq, J=8.9Hz), 7.56-7.49 (5H, m), 5.16(2H, s), 4.69(2H, d, J=5.6Hz), 4.36(1H, br t, J=12.4Hz), 2.37-2.20(2H, m), 2.09-1.97(2H, m), 1.91-1.78(
純度 >90% (NMR)		2H, m), 1.70-1.57 (1H, m), 1.50- 1.17 (3H, m)
MS 671 (M+1)		

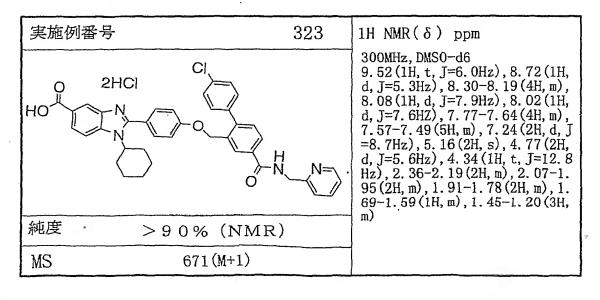


表 211

実施例番号	, 32	4	1H NMR(δ) ppm
НО	HCI CI HCI N N N N N N N N N N N N N		300MHz, DMSO-d6 8. 36 (1H, d, J=7. 9Hz), 8. 30 (1H, s), 8. 28and8. 05 (2H, ABq, J=8. 8 Hz), 8. 16 (1H, s), 7. 79and7. 46 (2H, A'B'q, J=8. 3Hz), 7. 74and7. 25 (4H, A'B''q, J=8. 9Hz), 7. 52and7. 50 (4H, A'' B'''q, J=8. 7Hz), 5. 14 (2H, s), 4. 36 (1H, brt, J=12. 1Hz), 3. 80 (1H, brs), 2. 39-2. 18 (2H, m), 2. 10-1. 98 (2H, m), 1. 93-1. 57 (8H, m), 1. 4
純度	>90% (NMR)		9-1.04(8H, m)
MS	662 (M+1)		

実施例番号		ć	325	1H NMR(δ) ppm
O 2H	HCI CI	H N O	N	300MHz, DMSO-d6 8. 86 (1H, t, J=6. OHz), 8. 84and8 .00 (4H, ABq, J=6. 6Hz), 8. 33 (1H, s), 8. 27and8. 04 (2H, A'B'q, J= 9. OHz), 8. 12 (1H, s), 7. 92and7. 46 (2H, A"B"q, J=7. 9Hz), 7. 74an d7. 23 (4H, A"B"q, J=9. OHz), 7 .53and7. 49 (4H, A""B""q, J=9. 1 Hz), 5. 13 (2H, s), 4. 36 (1H, br t, J=12. 8Hz), 3. 70 (2H, td, J=6. 8, 6. OHz), 3. 21 (2H, t, J=6. 8Hz)
純度	> 9 0 %	(NMR)		, 2. 38-2. 20 (2H, m), 2. 09-1. 95 2H, m), 1. 91-1. 77 (2H, m), 1. 70 1. 59 (1H, m), 1. 49-1. 20 (3H, m)
MS	685	(M+1)		1. 55 (111, m/, 1. 49 ⁻ 1. 20 (3 n , m/

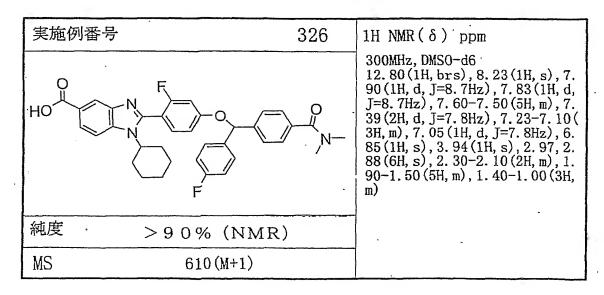


表 212

実施例番号 327	IH NMR(δ) ppm
HO N F OH	300MHz, DMSO-d6 13.20-12.60(2H, brs), 8.23(1H, s), 7.98(2H, d, J=6.6Hz), 7.95 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87(1H, d, J=8.7Hz), 7.70-7.50(5H, m), 7.27 -7.20(3H, m), 7.08(1H, d, J=7.8 Hz), 6.90(1H, s), 3.93(1H, s), 2 .51-2.05(2H, m), 1.90-1.70(4H, m), 1.65-1.55(1H, m), 1.40-1. 10(3H, m)
純度 > 90% (NMR)	
MS 583 (M+1)	

表 213

	HO ₂ C N	$ \begin{array}{c c} R' \\ 5 \\ \hline 0 \\ 1 \\ 2 \\ 3 \\ 4 \\ \hline R \end{array} $
実施例 番号	R	R'
2001	-H	4-(-Me)
2002	-H	3-(-CF ₃)
2003	5-(-F)	Н
2004	3-(-F)	2-(-F)
2005	3-(-F)	3-(-F)
2006	3-(-F)	4-(-F)
2007	4-(-F)	4-(-F)
2008	5-(-F)	4-(-F)
2009	6-(-F)	4-(-F)
2010	4-(-F)	4-(-Cl)
2011	5-(-F)	4-(-Me)
2012	5-(-F)	4-(-CF ₃)
2013	5-(-F)	4-(-CO ₂ H)
2014	5-(-F)	4-(-CO ₂ Me)
2015	5-(-F)	4- (-N)
2016	5-(-F)	4-(-CONH ₂)
2017	5-(-F)	4-{-CON(Me) ₂ }
2018	5-(-F)	4-(-OMe)
2019	5-(-F)	4-(-SMe)
2020	5-(-F)	(
2021	5-(-F)	$\left(egin{array}{c} 0 \ -\ddot{\ddot{S}}-\mathtt{Me} \ \ddot{0} \end{array} ight)$
2022	4-(-Cl)	-H
2023	4-(-Cl)	4-(-F)

2024	4-(-Cl)	4-(-Cl)
2025	4-(-Cl)	4-(-Me)
2026	5-(-Cl)	4-(-CF ₃)
2027	4-(-Cl)	4-(-CO ₂ H)
2028	5-(-Cl)	4-(-CO ₂ Me)
2029	5-(-Cl)	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ -1 \end{array}\right)$
2030	4-(-Cl)	4-(-CONH ₂)
2031	5-(-Cl)	4-{-CON(Me) ₂ }
2032	5-(-Cl)	3-(-OMe)
2033	4-(-Cl)	4-(-SMe)
2034	5-(-Cl)	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{\mathbb{S}}-Me \end{array}\right)$
2035	4-(-Cl)	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S} - Me \end{pmatrix}$
2036	5-(-CN)	4-(-F)
2037	4-(-CN)	4-(-Cl)
2038	5-(-NO ₂)	4-(-F)
2039	4-(-NO ₂)	4-(-Cl)
2040	5-(-Me)	4-(-CO ₂ H)
2041	5-(-Me)	4-(-CO ₂ Me)
2042	5-(-Me)	(
2043	5-(-CF ₃)	4-(-CO ₂ H)
2044	5-(-CF ₃)	4-(-CO ₂ Me)
2045	5-(-CF ₃)	4- (-N)
2046	5-(-CO ₂ H)	4-(-F)
2047	4-(-CO ₂ H)	4-(-Cl)
2048	5-(-CO ₂ Me)	4-(-F)
2049	5-(-CO ₂ Me)	4-(-Cl)
2050	5-(-Ac)	4-(-F)
2051	5-(-Ac)	4-(-Cl)
2052	5- (—N)	· -H

2053	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ N \end{array}\right)$	4-(-F)
2000	5-	1(1)
2054	5- (— N)	4-(-Cl)
2055	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ - \parallel \end{array}\right)$	4-(-CN)
2056	$\left(\begin{array}{c} 0\\ \parallel N \end{array}\right)$	4·(·NO ₂)
2057	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ \hline 1 \end{array}\right)$	4-(-Me)
2058	5- (— N)	4-(-CF ₃)
2059	$\left \begin{array}{c} \left(\begin{array}{c} 0 \\ \parallel \end{array} \right) \right $	4-(-Ac)
2060		4-(-CO ₂ H)
2061	5- (-N)	4-(-CO ₂ Me)
2062	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ -1 \end{array}\right)$	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ - 1 \end{array}\right)$
2063	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ - 1 \end{array}\right)$	4-(-CONH ₂)
2064	5- (-N)	4-{-CON(Me) ₂ }
2065	5- (- N)	4-{-C(=NH)NH ₂ }
2066	5- (-N)	4-(-OMe)
2067	5- (—N)	$ \begin{array}{c} \begin{array}{c} 0 \\ 4 \end{array} \\ \end{array} \left(\begin{array}{c} 0 \\ -0 \end{array} \right) \\ \end{array} $
2068		4-(-NHMe)
2069	5- (— N)	4-(-NHAc)
2070	$\left \begin{array}{c} 0 \\ 0 \\ 0 \end{array} \right $	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \end{pmatrix}$ 4-

2071	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ - 1 \end{array}\right)$	4-(-SMe)
2072	5- (—N)	4- (- Š-Me)
2073	5- (- N)	(\(\subseteq -\left(\subseteq -\left(\subseteq -\left(\subseteq -\left(\subseteq -\left(\subsete -\sinsete -\left(\subsete -\sinsete -\left(\subsete -\sinsete -\left(\subsete -\sinsete
2074	5- (-N)	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\stackrel{\circ}{\stackrel{\circ}{\stackrel{\circ}{\stackrel{\circ}{\stackrel{\circ}{\stackrel{\circ}{\stackrel{\circ}{\stackrel{\circ}$
2075	5- (N)	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{\ddot{s}} - N \text{ (Me)}_{2} \end{array} \right\} $
2076	5-(-CONH ₂)	-H
2077	5-(-CONH ₂)	4-(-F)
2078	5-(-CONH ₂)	2,3,4,5,6-penta-(-F)
2079	5-(-CONH ₂)	2-(-Cl)
2080	5-(-CONH ₂)	3-(-Cl)
2081	3-(-CONH ₂)	2-(-Cl)
2082	3-(-CONH ₂)	3-(-CI)
2083	3-(-CONH ₂)	4-(-Cl)
2084	4-(-CONH ₂)	2-(-Cl)
2085	4-(-CONH ₂)	3-(-CI)
2086	4-(-CONH ₂)	4-(-Cl)
2087	6-(-CONH ₂)	2-(-Cl)
2088	6-(-CONH ₂)	3-(-Cl)
2089	6-(-CONH ₂)	4-(-Cl)
2090	5-(-CONH ₂)	3,5-di-(-Cl)
2091	5-(-CONH ₂)	4-(-CN)
2092	5-(-CONH ₂)	4-(-NO ₂)
2093	5-(-CONH ₂)	4-(-Me)
2094	5-(-CONH ₂)	2,6-di-(-Me)
2095	5-(-CONH ₂)	4-(-CF ₃)
2096	5-(-CONH ₂)	4-(-Ac)
2097	5-(-CONH ₂)	4-(-CO ₂ H)
2098	5-(-CONH ₂)	4-(-CO ₂ Me)
2099	5-(-CONH ₂)	4- (-N)
2100	5-(-CONH ₂)	4-(-CONH ₂)

2101	5-(-CONH ₂)	3,5-di-(-CONH ₂)
2102	5-(-CONH ₂)	4-{-CON(Me) ₂ }
2103	5-(-CONH ₂)	4-{-C(=NH)NH ₂ }
2104	5-(-CONH ₂)	4-(-OMe)
2105	5-(-CONH ₂)	3,4,5-tri-(-OMe)
2106	5-(-CONH ₂)	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ -0 - CH_{2} \end{array}\right)$
2107	5-(-CONH ₂)	4-(-NHMe)
2108	5-(-CONH ₂)	4-(-NHAc)
2109	5-(-CONH ₂)	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \end{pmatrix}$
2110	5-(-CONH ₂)	4-(-SMe)
2111	5-(-CONH ₂)	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S}-Me \end{pmatrix}$
2112	5-(-CONH ₂)	$ \begin{array}{c c} 4^{-} \\ & \begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\$} - \text{Me} \end{pmatrix} \\ 4^{-} & 0 \end{array} $
2113	5-(-CONH ₂)	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\ddot{s}} - NH_2 \end{pmatrix}$
2114	5-(-CONH ₂)	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{\ddot{\varsigma}} - \text{N (Me)}_{2} \end{array} \right\} $
2115	5-{-CON(Me) ₂ }	·H
2116	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-F)
2117	4-{-CON(Me) ₂ }	4-(-Cl)
2118	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-CN)
2119	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-NO ₂)
2120	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-Me)
2121	4-{-CON(Me) ₂ }	4-(-CF ₃)
2122	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-Ac)
2123	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-CO ₂ H)
2124	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-CO ₂ Me)
2125	5-{-CON(Me) ₂ }	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ - 1 \end{array}\right)$
2126	5-{-CON(Me) ₂ }	3-(-CONH ₂)
2127	4-{-CON(Me) ₂ }	4-{-CON(Me) ₂ }
2128	5-{-CON(Me) ₂ }	4-{-C(=NH)NH ₂ }
1		

2129	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-QMe)
2130	5-{-CON(Me) ₂ }	
2131	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-NHMe)
2132	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-NHAc)
2133	5-{-CON(Me) ₂ }	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \\ H & \ddot{0} \end{pmatrix}$
2134	4-{-CON(Me) ₂ }	4-(-SMe)
2135	5-{-CON(Me) ₂ }	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S}-Me \end{pmatrix}$
2136	4-{-CON(Me) ₂ }	$\begin{pmatrix} 0\\ -\ddot{S}-Me \end{pmatrix}$
2137	5-{-CON(Me) ₂ }	$\begin{pmatrix} 0\\ -\ddot{\ddot{s}}-NH_2 \end{pmatrix}$
2138	5-{-CON(Me) ₂ }	4- { - \$ - N (Me) 2 }
2139	5-(-OMe)	-H
2140	5-(-OMe)	4-(-F)
2141	3-(-OMe)	4-(-Cl)
2142	4-(-OMe)	4-(-Cl)
2143	5-(-OMe)	2-(-Cl)
2144	5-(-OMe)	3-(-Cl)
2145	6-(-OMe)	4-(-Cl)
2146	5-(-OMe)	4-(-CN)
2147	5-(-OMe)	4-(-NO ₂)
2148	5-(-OMe)	4-(-Me)
2149	5-(-OMe)	4-(-CF ₈)
2150	5-(-OMe)	4-(-Ac)
2151	4-(-OMe)	4-(-CO ₂ H)
2152	4,5-di-(-OMe)	4-(-CO ₂ H)
2153	5-(-OMe)	4-(-CO ₂ Me)
2154	5-(-OMe)	$\frac{1}{4}$
2155	5-(-OMe)	4-(-CONH ₂)
2156	5-(-OMe)	4-{-CON(Me) ₂ }

	× / 07.5	1 ((()()())())
2157	5-(-OMe)	4-{-C(=NH)NH ₂ }
2158	5-(-OMe)	4-(-OMe)
2159	5-(-OMe)	
2160	5-(-OMe)	4-(-NHMe)
2161	5-(-OMe)	4-(-NHAc)
2162	5-(-OMe)	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \end{pmatrix}$
2163	5-(-OMe)	4-(-SMe)
2164	5-(-OMe)	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S}-Me \end{pmatrix}$
2165	5-(-OMe)	$\left(egin{array}{c} 0 \ -\ddot{\ddot{S}} - Me \end{array} ight)$
2166	5-(-OMe)	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\ddot{S}} - NH_2 \end{pmatrix}$
2167	5-(-OMe)	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{\ddot{S}} - N \text{ (Me)}_{2} \end{array} \right\} $
2168	5-(-NHMe)	4-(-F)
2169	5-(-NHMe)	4-(-Cl)
2170	5-(-NHAc)	4-(-F)
2171	5-(-NHAc)	4-(-Cl)
2172	5-(-NHAc)	4-(-Ac)
2173	5-(-NHAc)	4-(-CONH ₂)
2174	5-(-NHAc)	4-{-CON(Me) ₂ }
2175	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \\ H \ddot{O} \end{pmatrix}$	4-(-F)
2176	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \\ H & \ddot{0} \end{pmatrix}$	4-(-Cl)
2177	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \\ H & 0 \end{pmatrix}$	4-(-Me)
2178	0 N-S-Me)	4-(-CF ₃)
2179	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \end{pmatrix}$	4-(-CO ₂ H)

2180	0 N-S-Me)	4-(-CO₂Me)
2181	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ -N - \ddot{S} - Me \end{array} \right)$	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ -1 \end{array}\right)$
2182	0 H 0 5-	4-(-SMe)
2183	0 - (-N-S-Me) 5-	0 4- (—Š—Me)
2184	0 - (-N-S-We)	$\left(egin{array}{c} 0 \ \ddot{\ddot{s}}$ —Me $\left(egin{array}{c} 0 \ \ddot{\ddot{s}}$ —Me $\left(egin{array}{c} 0 \ \ddot{\ddot{s}} \end{array} \right)$
2185	5-(-SMe)	4-(-F)
2186	4-(-SMe)	4-(-Cl)
2187	5-(-SMe)	4-(-Me)
2188	· 5-(-SMe)	4-(-CF ₃)
2189	5-(-SMe)	4-(-Ac)
2190	5-(-SMe)	4-(-CONH ₂)
2191	5-(-SMe)	4-{-CON(Me) ₂ }
2192	0 5- (-S-Me)	4-(-F)
2193	4- (- Š-Me)	4-(-Cl)
2194	0 5- (—Š—Me)	4-(-Me)
2195	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S}-Me \end{pmatrix}$	4-(-CF ₃)
2196	(4-(-Ac)
2197	0 5- (4-(-CONH ₂)
2198	(-S-Me)	4-{-CON(Me) ₂ }
2199	(4-(-F)
2200	$\begin{pmatrix} 0\\ -\ddot{\S}-{ m Me} \end{pmatrix}$	4-(-Cl)
2201	(4-(-Me)

2202	(4-(-CF ₃)
2203	0 - S-Me)	4-(-Ac)
2204	(-S-Me)	4-(-CONH ₂)
2205	(- S-Me)	4-{-CON(Me) ₂ }
2206	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\ddot{s}} - NH_2 \end{pmatrix}$	4-(-F)
2207	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S}-NH_2 \end{pmatrix}$	4-(-CI)
2208	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\S} - NH_2 \end{pmatrix}$	2,4-di-(-Cl)
2209	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S} - NH_2 \end{pmatrix}$ 5-	4-(-Me)
2210	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S} - NH_2 \end{pmatrix}$	3-(-CF ₃)
2211	5- (4-(-CF ₈)
2212	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\ddot{s}} - NH_2 \end{pmatrix}$	4-(-CONH ₂)
2213	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S} - NH_2 \end{pmatrix}$	4-{-CON(Me) ₂ }
2214	5- (-\$-NH ₂)	4-(-SMe)
2215	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{S} - NH_2 \end{array} \right)$	4- (0 - S-Me)
2216	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\ddot{s}} - NH_2 \end{pmatrix}$	$\left(egin{array}{c} 0 \ -\ddot{\ddot{\mathbf{s}}} - \mathtt{Me} \end{array} ight)$
2217	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{\$} - N \left(Me\right)_2 \end{array} \right\} $	4-(·F)
2218	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{\$} - N \left(Me\right)_{2} \end{array} \right\} $	4-(-Cl)

0234		
2219	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{\ddot{s}} - N \text{ (Me) }_2 \end{array} \right\} $	4-(-Me)
2220	$\left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{S} - N \text{ (Me)}_{2} \end{array} \right\}$	4-(-CF ₃)
2221	$\left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{S} - N \text{ (Me)}_2 \end{array} \right\}$	4-(-CONH ₂)
2222	$\left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{S} - N \text{ (Me)}_{2} \end{array} \right\}$	4-{-CON(Me) ₂ }
2223	$\left\{ \begin{array}{c} 0\\ -\ddot{S}-N \text{ (Me)}_2 \end{array} \right\}$	4-(-SMe)
2224	$\left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{S} - N \text{ (Me)}_{2} \end{array} \right\}$	0 4- (—Š-Me)
2225	$\left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{\mathbb{S}} - N \left(Me\right)_2 \end{array} \right\}$	$\left(egin{array}{c} 0 \ \ddot{\ddot{s}}$ —Me $\left(egin{array}{c} 0 \ \ddot{\ddot{s}}$
2226	5-{-O-(CH ₂) ₂ -OH}	4-(-Cl)
2227	5-{-O-(CH ₂) ₃ -OH}	4-(-Cl)
2228	5- (-0)	4-(-CI)
2229	5- (-0)	4-(-Cl)
2230		4-(-CI)
2231	5- (-0 N OH)	4-(-Cl)
2232	5- (-0 N OH)	4-(-Cl)
2233	0 N OH)	4-(-Cl)
2234	5- (N OH)	4-(-Cl)
2235	5- (N OH)	4-(-Cl)

2236	5- (N OH)	4-(-Cl)
2237	(N CO ₂ H)	4-(-Cl)
2238	O Me Me N Me Me	4-(-Cl)
2239	O Me Me Me Me OH	4-(-Cl)
2240	5- (N OMe	4-(-Cl)
2241	5- (N)	4-(-Cl)
2242	5- (N)	4-(-Cl)
2243	5- (N N S Me)	4-(-C1)
2244		4-(-Cl)
2245	5- (N S=0)	4-(-CI)
2246	5- (NOH)	4-(-Cl)
2247	5- (N)	4-(-Cl)
2248	(, O)) ,	4-(-Cl)
2249	5- (N OH)	4-(-Cl)

2250	5- (0 N S Me) 5-	4-(-CI)
2251		4-(-Cl)
2252		4-(-Cl)
2253	5- (Ne N)	4-(-CI)
2254	5- (N N Me)	4-(-C1)

表 214

		R' 4 3
	HO ₂ C N	5 2 6 1 2 3 0 1 6 5 R
実施例番号	R	R'
2255	-H	-H
2256	-H	4-(-Me)
2257	-H	3-(-CF ₃)
2258	5·(·F)	-Н
2259	5-(-F)	4-(-F)
2260	5-(-F)	4-(-Cl)
2261	5-(-F)	4-(-Me)
2262	5-(-F)	4-(-CF ₃)
2263	5-(-F)	4-(-CO ₂ H)
2264	5-(-F)	4-(-CO ₂ Me)
2265	5-(-F)	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ - \end{array}\right)$
2266	5-(-F)	4-(-CONH ₂)
2267	5-(-F)	4-{-CON(Me) ₂ }
2268	5-(-F)	4-(-OMe)
2269	5-(-F)	4-(-SMe)
2270	5-(-F)	(- S-Me)
2271	5-(-F)	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\S} - Me \end{pmatrix}$
2272	4-(-Cl)	·H
2273	5-(-Cl)	4-(-F)
2274	4-(-Cl)	4-(-Cl)
2275	5-(-Cl)	4-(-Me)
2276	5-(-CI)	4-(-CF ₃)
2277	5-(-Cl)	4-(-CO ₂ H)

2278	5-(-Cl)	4-(-CO ₂ Me)
2279	5-(-Cl)	4- (-N)
2280	5-(-Cl)	4-(-CONH ₂)
2281	5-(-Cl)	4-{-CON(Me) ₂ }
2282	5-(-Cl)	4-(-OMe)
2283	5-(-Cl)	4-(-SMe)
2284	5-(-Cl)	(- S-Me)
2285	5-(-Cl)	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{s} - \text{Me} \end{pmatrix}$
2286	5-(-CN)	4-(-F)
2287	5-(-CN)	4-(-Cl)
2288	5-(-NO ₂)	4-(-F)
2289	5-(-NO ₂)	4-(-Cl)
2290	5·(-Me)	4-(-CO ₂ H)
2291	5-(-Me)	4-(-CO ₂ Me)
2292	5-(-Me)	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ - \\ 4 \end{array}\right)$
2293	5-(-CF ₃)	4-(-CO ₂ H)
2294	5-(-CF ₃)	4-(-CO ₂ Me)
2295	5-(-CF ₃)	4- (-N)
2296	5-(-CO ₂ H)	4-(-F)
2297	4-(-CO ₂ H)	4-(-Cl)
2298	5-(-CO ₂ Me)	4-(-F)
2299	5-(-CO ₂ Me)	4-(-Cl)
2300	5-(-Ac)	4-(·F)
2301	5-(-Ac)	4-(-Cl)
2302	5- (—N)	-H
2303	5- (—N)	4-(-F)
2304	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ \hline 1 \end{array}\right)$. 4-(-Cl)

254		1 C1/31 02/
2305	5- (-N)	4-(-CN)
2306	5- (-N)	4-(-NO ₂)
2307	5- (-N)	4-(-Me)
2308	5- (-N)	4-(-CF ₃)
2309	5- (—N)	4-(-Ac)
2310	5- (- N)	4-(-CO ₂ H)
2311	5- (- -N)	4-(-CO ₂ Me)
2312	5- (- N)	4- (- N)
2313	5- (-N)	4-(-CONH ₂)
2314	5- (—N)	4-{-CON(Me) ₂ }
2315	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ -1 \end{array}\right)$	4-{-C(=NH)NH ₂ }
2316	5- (—N)	4-(-OMe)
2317		
2318	5- (— N)	4-(-NHMe)
2319	5- (- N)	4-(-NHAc)
2320	5- (- N)	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \end{pmatrix}$
. 2321	5- (-N)	4-(-SMe)
2322	5- (—N)	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S}-Me \end{pmatrix}$
	497	

254		
2323	5- (- -N\)) ·	$\begin{pmatrix} 0\\ -\ddot{s}-\text{Me} \end{pmatrix}$
2324	(N)	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\ddot{s}} - NH_2 \end{pmatrix}$
2325	$_{5^{-}}\left(\begin{array}{c} 0 \\ - \parallel \\ \end{array} \right)$	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{\$} - N \text{ (Me)}_2 \end{array} \right\} $
2326	5-(-CONH ₂)	-H
2327	5-(-CONH ₂)	4-(-F)
2328	4-(-CONH ₂)	4-(-Cl)
2329	5-(-CONH ₂)	4-(-CN)
2330	5-(-CONH ₂)	4-(-NO ₂)
2331	5-(-CONH ₂)	4-(-Me)
2332	5-(-CONH ₂)	4-(-CF ₃)
2333	5-(-CONH ₂)	4-(-Ac)
2334	5-(-CONH ₂)	4-(-CO ₂ H)
2335	5-(-CONH ₂)	4-(-CO ₂ Me)
2336	5-(-CONH ₂)	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ -1 \end{array}\right)$
2337	5-(-CONH ₂)	4-(-CONH ₂)
2338	5-(-CONH ₂)	4-{-CON(Me) ₂ }
2339	5-(-CONH ₂)	4-{-C(=NH)NH ₂ }
2340	5-(-CONH ₂)	4-(-OMe)
2341	. 5-(-CONH ₂)	
2342	5-(-CONH ₂)	4-(-NHMe)
2343	5-(-CONH ₂)	4-(-NHAc)
2344	5-(-CONH ₂)	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \end{pmatrix}$
2345	5-(-CONH ₂)	4-(-SMe)
2346	5-(-CONH ₂)	4- (-S-Me)
2347	5-(-CONH ₂)	4- (-\$ -Me)
2348	5-(-CONH ₂)	$\begin{pmatrix} -\ddot{\ddot{s}} - NH_2 \end{pmatrix}$
L	438	

J. T		
2349	5-(-CONH ₂)	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{S} - N \text{ (Me)}_{2} \end{array} \right\} $
2350	5-{-CON(Me) ₂ }	-H
2351	5-{-CON(Me) ₂ }	4·(·F)
2352	4-{-CON(Me) ₂ }	4-(-Cl)
2353	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-CN)
2354	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-NO ₂)
2355	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-Me)
2356	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-CF ₃)
2357	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-Ac)
2358	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-CO ₂ H)
2359	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-CO ₂ Me)
2360	5-{-CON(Me) ₂ }	4- (- N)
2361	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-CONH ₂)
2362	5-{-CON(Me) ₂ }	4-{-CON(Me) ₂ }
2363	5-{-CON(Me) ₂ }	4-{-C(=NH)NH ₂ }
2364	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-OMe)
2365	5-{-CON(Me) ₂ }	
2366	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-NHMe)
2367	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-NHAc)
2368	5-{-CON(Me) ₂ }	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \end{pmatrix}$
2369	5-{-CON(Me) ₂ }	4-(-SMe)
2370	5-{-CON(Me) ₂ }	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\mathbb{S}}-Me \end{pmatrix}$
2371	5-{-CON(Me) ₂ }	$\left(egin{array}{c} 0 \ \ddot{\ddot{S}} - \mathtt{Me} \end{array} ight)$
2372	5-{-CON(Me)2}	4 - $\begin{pmatrix} 0\\ -\ddot{5}-NH_2 \end{pmatrix}$
2373	5-{-CON(Me) ₂ }	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{\ddot{s}} - N \text{ (Me) }_{2} \end{array} \right\} $
2374	5-(-OMe)	-H

2375	5-(-OMe)	4-(-F)
2376	5-(-OMe)	4-(-Cl) ·
2377	5-(-OMe)	4-(-CN)
2378	5-(-OMe)	4-(-NO ₂)
2379	5-(-OMe)	4-(-Me)
2380	5-(-OMe)	4-(-CF ₃)
2381	5-(-OMe)	4-(-Ac)
2382	5-(-OMe)	4-(-CO ₂ H)
2383	5-(-OMe)	4-(-CO ₂ Me)
2384	5-(-OMe)	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ -1 \end{array}\right)$
2385	5-(-OMe)	4-(-CONH ₂)
2386	5-(-OMe)	4-{-CON(Me) ₂ }
2387	5-(-OMe)	4-{-C(=NH)NH ₂ }
2388	5-(-OMe)	4-(-OMe)
2389	5-(-OMe)	
2390	5-(-OMe)	4-(-NHMe)
2391	5-(-OMe)	4-(-NHAc)
2392	5-(-OMe)	$\begin{pmatrix} 0 \\ -N - \ddot{S} - Me \end{pmatrix}$
2393	5-(-OMe)	4-(-SMe)
2394	5-(-OMe)	$4^{-}\left(\overset{0}{-\overset{\circ}{S}-Me}\right)$
2395	5-(-OMe)	$\begin{pmatrix} 0\\ -\ddot{s}-\text{Me} \end{pmatrix}$
2396	5-(-OMe)	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\ddot{s}} - NH_2 \end{pmatrix}$
2397	5-(-OMe)	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{s} - N \text{ (Me)}_2 \end{array} \right\} $
2398	5-(-NHMe)	4-(-F)
2399	5-(-NHMe)	4-(-Cl)
· 2400	5-(-NHAc)	4-(-F)
2401	5-(-NHAc)	4-(-Cl)
2402	5-(-NHAc)	4-(-Ac)

2403	5-(-NHAc)	4-(-CONH ₂)
2404	5-(·NHAc)	4-{-CON(Me) ₂ }
2405	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \end{pmatrix}$	4-(-F)
2406	$ \begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \\ H & 0 \end{pmatrix} $	4-(-Cl)
2407	5- (-N-S-Me) 5- (-N-S-Me)	4-(-Me)
2408	(-N-S-We)	4-(-CF ₃)
2409	0 - N-S-Me) 5- (N-S-Me)	4-(-CO ₂ H)
2410	5- (-N-S-Me)	4-(-CO ₂ Me)
2411	5- (-N-3-Me)	4 - $\left(\begin{array}{c} 0 \\ \parallel N \end{array}\right)$
2412	(-N-S-Me)	4-(-SMe)
2413	(-N-S-Me)	4- (0 4- Š-Me)
2414	$ \left(\begin{array}{c} 0 \\ -N - \ddot{S} - Me \\ H \ddot{0} \end{array} \right) $	$\left(egin{array}{c} 0 \\ -\ddot{\ddot{S}} - \mathtt{Me} \\ \ddot{0} \end{array} ight)$
2415	5-(-SMe)	4-(-F)
2416	5-(-SMe)	4-(-Cl)
2417	5-(-SMe)	4-(-Me)
2418	5-(-SMe)	4-(-CF ₃)
2419	5-(-SMe)	4-(-Ac)
2420	5-(-SMe)	4-(-CONH ₂)
2421	5-(-SMe)	4-{-CON(Me) ₂ }
2422	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\mathbb{S}}-Me \end{pmatrix}$	4-(-F)
2423	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S}-Me \end{pmatrix}$	4-(-Cl)
2424	(-S-Me)	4-(-Me)

F ₃)
(c)
NH2)
(Me) ₂ }
F)
CI)
Me)
CF3)
Ac)
)NH ₂)
N(Me) ₂ }
-F)
·Cl)
Me)
CF ₃)
ONH2)
N(Me) ₂ }
SMe)

207		
2443	$\begin{pmatrix} 0\\ -\ddot{\ddot{s}}-NH_2 \end{pmatrix}$	(S-Me)
2444	$\begin{pmatrix} 0\\ -\ddot{S}-NH_2 \end{pmatrix}$	$\begin{pmatrix} -\ddot{\ddot{s}} - \text{Me} \end{pmatrix}$
2445	$\left\{ \begin{array}{c} 0\\ -\stackrel{\circ}{\stackrel{\circ}{\stackrel{\circ}{\stackrel{\circ}{\circ}}}} = N \text{ (Me) }_2 \end{array} \right\}$	4-(-F)
2446	$\left\{ egin{array}{c} 0 \ -\ddot{\ddot{s}} - N \left(\mathrm{Me} ight)_2 \end{array} ight\}$	4-(-Cl)
2447	$\left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{S} - N \text{ (Me)}_{2} \end{array} \right\}$	4-(-Me)
2448	$\left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{\ddot{S}} - N \text{ (Me) }_{2} \end{array} \right\}$	4-(-CF ₃)
2449	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{\$} - N \left(Me\right)_2 \end{array} \right\} $	4-(-CONH ₂)
2450	$\left\{\begin{array}{c}0\\-\ddot{\$}-N\left(Me\right)_{2}\end{array}\right\}$	4-{·CON(Me) ₂ }
2451	$\left\{\begin{array}{c}0\\-\ddot{S}-N(\text{Me})_2\end{array}\right\}$	4-(-SMe)
2452	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{S} - N \text{ (Me)}_{2} \end{array} \right\} $	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S}-Me \end{pmatrix}$
2453	$\left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{S} - N \text{ (Me)}_{2} \end{array} \right\}$	$\begin{pmatrix} 0\\ -\ddot{s}-\text{Me} \end{pmatrix}$

表 215

$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$		
実施例 番号	R	R'
2454	2-(-F)	2-(-F)
2455	2-(-F)	3-(-F)
2456	2-(-F)	4-(-F)
2457	3-(-C1)	3-(-Cl)
2458	3,5-di-(-Cl)	3,5-di-(-Cl)
2459	3-(-CN)	3-(-CN)
2460	3-(-NO ₂)	3-(-NO ₂)
2461	3-(-Me)	3-(-Me)
2462	3-(-CF ₃)	3-(-CF3)
2463	3-(-Ac)	3-(-Ac)
2464	3-(-CO ₂ H)	3-(-CO ₂ H)
2465	3-(-CO ₂ Me)	3-(-CO₂Me)
2466	3- (-N)	$g_{-}\left(\begin{array}{c} 0 \\ 0 \end{array}\right)$
2467	3-(-CONH ₂)	3-(-CONH ₂)
2468	3-(-CONH ₂)	3-(-F)
2469	3-(-CONH ₂)	3-(-Cl)
2470	3-{-CON(Me) ₂ }	3-{-CON(Me) ₂ }
2471	3-{-CON(Me) ₂ }	3-(-F)
2472	3-{-CON(Me) ₂ }	3-(-Cl)
2473	3-{-C(=NH)NH ₂ }	3-{-C(=NH)NH ₂ }
2474	3-(-OMe)	3-(-OMe)
2475		$3-\left(-0-CH_{2} N\right)$
2476	3-(-NHMe)	3-(-NHMe)
2477	3-(-NHAc)	3-(-NHAc)
2478	3- (-N-S-We)	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \end{pmatrix}$

2479	3-(-SMe)	3-(-SMe)
2480	3- (−S−Me)	3- (- S-Me)
2481	0 (—ÿ−Me) 3-	$\left(\begin{array}{c} -\ddot{s} - \text{Me} \\ \ddot{0} \end{array}\right)$
2482	$\begin{pmatrix} -\overset{0}{\overset{\circ}{\overset{\circ}{\overset{\circ}{\overset{\circ}{\overset{\circ}{\overset{\circ}{\overset{\circ}{$	$\begin{pmatrix} 0\\ -\ddot{\ddot{S}} - NH_2 \end{pmatrix}$
2483	$\left\{ egin{array}{c} 0 \ -\ddot{\ddot{5}} - \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \$	$\left\{ \begin{array}{c} 0\\ -\ddot{\ddot{s}} - N \text{ (Me)}_{2} \end{array} \right\}$
2484	3-(-F)	4-(-F)
2485	3-(-CI)	4-(-Cl)
2486	4-(-CN)	4-(-CN)
2487	4-(-NO ₂)	4-(-NO ₂)
2488	3-(-Me)	4-(-Me)
2489	4-(-Me)	2,6-di-(-Me)
2490	4-(-CF ₃)	4-(-CF ₃)
2491	4-(-Ac)	4-(-Ac)
2492	4-(-CO ₂ H)	4-(-CO ₂ H)
2493	4-(-CO ₂ Me)	4-(-CO ₂ Me)
2494	4 - $\left(\begin{array}{c} 0 \\ -1 \\ -1 \end{array}\right)$	4 $\left(\begin{array}{c} 0 \\ -1 \end{array}\right)$
2495	4-(-CONH ₂)	4-(-CONH ₂)
2496	4-(-CONH ₂)	4-(-F)
2497	4-(-CONH ₂)	2,3,4,5,6-penta-(-F)
2498	4-(-CONH ₂)	4-(-Cl)
2499	4-{-CON(Me) ₂ }	4-{-CON(Me) ₂ }
2500	4-{-CON(Me) ₂ }	4-(-F)
2501	4-{-CON(Me) ₂ }	4-(-Cl)
2502	4-{-CON(Me) ₂ }	3,5-di-(-Cl)
2503	4-{-C(=NH)NH ₂ }	4-{-C(=NH)NH ₂ }
2504	4-(-OMe)	4-(-OMe)
2505	4-(-OMe)	3,4,5-tri-(-OMe)
, 2506		$4 - \left(-0 - CH_{2} - N\right)$
2507	4-(-NHMe)	4-(-NHMe)

2508	4-(-NHAe)	4-(-NHAc)
2509	(N S Me)	(N S Me)
2510	4-(-SMe)	4-(-SMe)
2511	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S} - Me \end{pmatrix}$	$\left(\begin{array}{c}0\\-\dot{s}-Me\end{array}\right)$
2512	$\begin{pmatrix} 0\\ -\ddot{S}-Me \\ 0 \end{pmatrix}$	(S- Me)
2513	4- (· Š- NH ₂)	$\begin{pmatrix} 0 \\ - \ddot{S} - NH_2 \end{pmatrix}$
2514	$\left\{\begin{array}{c} 0\\ -\ddot{S}-N \text{ (Me)}_{2} \end{array}\right\}$	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\overset{\circ}{\overset{\circ}{\overset{\circ}{\circ}}} N (Me)_{2} \end{array} \right\} $

表 216

$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$				
実施例 番号	R	R'		
2515	-Н	-H		
2516	2-(-F)	3-(-F)		
2517	3-(-Cl)	3-(-CI)		
2518	3-(-CN)	3-(-CN)		
2519	3-(-NO ₂)	3-(-NO ₂)		
2520	3-(-Me)	3-(-Me)		
2521	3-(-CF ₃)	3-(-CF ₃)		
2522	3-(-Ac)	3-(-Ac)		
2523	3-(-CO ₂ H)	3-(-CO ₂ H)		
2524	3-(-CO ₂ Me)	3-(-CO₂Me)		
2525	3- (-N)	3 - $\left(\begin{array}{c} 0 \\ -1 \\ -1 \end{array}\right)$		
2526	3-(-CONH ₂)	3-(-CONH ₂)		
2527	3-(-CONH ₂)	3-(-F)		
2528	3-(-CONH ₂)	3-(-Cl)		
2529	3-{-CON(Me) ₂ }	3-{-CON(Me) ₂ }		
2530	3-{-CON(Me) ₂ }	3-(-F)		
2531	3-{-CON(Me) ₂ }	3-(-CI)		
2532	3-{-C(=NH)NH ₂ }	3-{-C(=NH)NH ₂ }		
2533	3-(-OMe)	3-(-OMe)		
2534		$ \frac{1}{3} \left(-0 - CH_{\frac{1}{2}} N \right) $		
2535	3-(-NHMe)	3-(-NHMe)		
2536	3-(-NHAc)	3-(-NHAc)		
2537	3- (-H-S-We)	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \end{pmatrix}$		
2538	3-(-SMe)	3-(-SMe)		

254		
2539	. (- S-Me)	3- (-S-Me)
2540	ე (— Š—Me) შ-	3- (
2541	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\ddot{s}} - NH_2 \end{pmatrix}$	$\begin{pmatrix} -\ddot{\ddot{s}} - NH_2 \end{pmatrix}$ 3-
2542	$\left\{ \begin{array}{c} 0\\ -\ddot{S}-N \left(Me\right)_{2} \end{array} \right\}$ 3-	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{S} - N \text{ (Me)}_{2} \end{array} \right\} $ 3-
2543	3-(-F)	4-(-F)
2544	4-(-Cl)	4-(-Cl)
2545	4-(-CN)	4-(-CN)
2546	4-(-NO ₂)	4-(-NO ₂)
2547	4-(-Me)	4-(-Me)
2548	4-(-CF ₃)	4-(-CF ₃)
2549	4-(-Ac)	4-(-Ac)
2550	3-(-CO ₂ H)	4-(-CO ₂ H)
2551	4-(-CO ₂ Me)	4-(-CO ₂ Me)
2552	$\left(\begin{array}{c} 0 \\ - \\ \end{array}\right)$	4 - $\left(\begin{array}{c} 0 \\ \\ \\ \end{array}\right)$
2553	4-(-CONH ₂)	4-(-CONH ₂)
2554	4-(-CONH ₂)	4-(-F)
2555	4-(-CONH ₂)	4-(-Cl)
2556	3-{-CON(Me) ₂ }	4-{-CON(Me) ₂ }
2557	3-{-CON(Me) ₂ }	4-(-F)
2558	4-{-CON(Me) ₂ }	4-(-Cl)
2559	4-{-C(=NH)NH ₂ }	4-{-C(=NH)NH ₂ }
2560	4-(-OMe)	4-(-OMe)
2561	$ \frac{1}{4} \left(-0 - CH_{2} $	
2562	4-(-NHMe)	4-(-NHMe)
2563	4-(-NHAc)	4-(-NHAc)
2564	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \end{pmatrix}$ 4-	$\begin{pmatrix} -N - \ddot{S} - Me \\ H & \ddot{0} \end{pmatrix}$
2565	4-(-SMe)	4-(-SMe)
2566	4- (_—Š-Me)	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{S}-Me \end{pmatrix}$
	440	

2567	$\left(egin{array}{c} 0 \\ -\ddot{S} - Me \\ \ddot{O} \end{array} ight)$	$\left(egin{matrix} 0 \\ -\ddot{\ddot{s}} \\ \ddot{0} \end{smallmatrix} ight)$
2568	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\ddot{5}} - NH_2 \end{pmatrix}$	$\begin{pmatrix} 0 \\ -\ddot{\ddot{s}} - NH_2 \end{pmatrix}$
2569	$\left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{s} - N \text{ (Me)}_{2} \end{array} \right\}$	$ \left\{ \begin{array}{c} 0 \\ -\ddot{S} - N \text{ (Me)}_{2} \end{array} \right\} $

表 217

	HO ₂ C N Py	2 3 4 6 5 R'
		Py: ピリジル基
実施例番号	Ру	R'
2570	3-Py ·	-H
2571	3-Ру	3-(-F)
2572	3-Py	3-(-C1)
2573	3-Py	3-(-Me)
2574	3-Py	3-(-CF ₃)
2575	3-Py	3-(-Ac)
2576	3-Py	3-(-CO ₂ H)
2577	3-Py	3-(-CO ₂ Me)
2578	3-Ру	3- (—N)
2579	3-Py	3-(-CONH ₂)
2580	3-Py	3-{-CON(Me) ₂ }
2581	3-Py	4-(-F)
2582	3-Ру	4-(-Cl)
2583	3-Ру	4-(-Me)
2584	3-Ру	4-(-CF ₃)
2585	3-Ру	4-(-Ac)
2586	2-Py	4-(-CO ₂ H)
2587	3-Py	4-(-CO ₂ Me)
2588	3-Py	$\begin{pmatrix} \begin{pmatrix} 0 \\ -1 \end{pmatrix} \\ 4 \end{pmatrix}$
2589	4-Py	4-(-CONH ₂)
2590	3-Py	4-{-CON(Me) ₂ }

表 218

	HO ₂ C N F O Py	2 3 4 6 5 R'
ri=1/- (a)		Py: ピリジル基
実施例 番号	Ру	R'
2591	.3-Py	·H
2592	3-Py	3-(-F)
2593	3-Py	3-(-CI)
2594	3-Py	3-(-Me)
2595	3-Py	3-(-CF ₃)
2596	3-Py	3-(-Ac)
2597	3-Py	3-(-CO ₂ H)
2598	3-Py	3-(-CO ₂ Me)
2599	3-Ру	3- (N)
2600	3-Py	3-(-CONH ₂)
2601	3-Py	3-{-CON(Me) ₂ }
2602	3-Ру	4-(-F)
2603	3-Py	4-(-Cl)
2604	3-Ру	4-(-Me)
2605	3-Py	4-(-CF ₃)
2606	3-Py	4-(-Ac)
2607	3-Ру	4-(-CO ₂ H)
2608	3-Ру	4-(-CO ₂ Me)
2609	3-Ру	$\left \begin{array}{c} \begin{pmatrix} 0 \\ - \\ 1 \end{pmatrix} \\ 4 \end{array}\right.$
2610	3-Py	4-(-CONH ₂)
2611	3-Py	4-{-CON(Me) ₂ }

表 219

実施例	番号	328	1H NMR(δ
НО	HCI CI	N_=0	300MHz, DMS 8. 29 (1H, s) Hz), 8. 02 (1 0 (1H, s), 7. , 7. 61 (1H, c . 45 (3H, m), z), 7. 22 (2H (2H, s,), 4. 40 (4H, m), 2 . 10-1. 90 (2H, m), 1. 65- 1. 10 (3H, m)
純度	> 9 0 % (NMR)	1. 10 (511, 11.)
MS	662 (M+1)		

) ppm

S0-d6), 8. 23 (1H, d, J=9. 0 1H, d, J=8.4Hz), 7.8 . 71 (2H, d, J=8. 4Hz) d, J=9.3Hz), 7.55-7 , 7. 46 (2H, d, J=8. 1H 2H, d, J=8. 7Hz), 5. 16 4. 34 (1H, m), 4. 20-3. 2.60-2.15(6H, m), 2 2H, m), 1.85-1.70(2 -1.55(1H, m), 1.50-

実施例番号	329 .
НО	HCI CI OH
純度	> 9 0% (NMR)
MS	553 (M+1)

1H NMR(δ) ppm

400MHz, DMSO-d6 9.80(1H, brs), 8.32(1H, s), 8.3 0(1H, d, J=8. 8Hz), 8. 06(1H, d, J=8. 8Hz), 7. 74(2H, d, J=8. 6Hz), 7. 44H, m), 7. 22(1H, d, J=8. 6Hz), 7. 48-7. 37(4H, d, J=8. 6Hz), 7. 48-7. 38(4Hz), 7. 48-7. 38(=8.6Hz), 7.17(1H, d, J=8.2Hz), 7.05(1H, d, J=2.3Hz), 6.88(1H, dd, J=8. 3, 2. 5Hz), 5. 04 (2H, s), 4.37(1H, m), 2.37-2.22(2H, m), 2.11-1.98(2H, m), 1.93-1.81(2 H, m), 1. 70-1. 58 (1H, m), 1. 56-1 . 22 (3H, m)

実施例番号	330	1H
HCI CI N N N N	O H	30 8. s) 1H 96 J= 25 ,4 61
純度 >90%(]	NMR)	31
MS 622 (M-	-1)	

 $NMR(\delta)$ ppm

OMHz, DMSO-d6 38(1H, d, J=7.5Hz), 8, 32(1H, , 8. 29 (1H, d, J=9. 0Hz), 8. 16 (H, s), 8. 05 (1H, d, J=9. 0Hz), 7. 6 (1H, d, J=7. 5Hz), 7. 75 (2H, d, =8.4Hz), 7.53-7.43(5H, m), 7. 5(2H, d, J=8.4Hz), 5.13(2H, s) 4.36(1H, m), 4.12(1H, sept, J= 9Hz), 2. 40-2. 15(2H, m), 2. 10 1.95(2H, m), 1.90-1.75(2H, m) 1.70-1.55(1H, m), 1.50-1.20(H, m), 1.18 (6H, d, J=6.6Hz)

実施例番号	331	1H NMR(δ) ppm
HCI HO N		300MHz, DMSO-d6 8. 31 (1H, s), 8. 27 (1H, d, J=8. 7H z), 8. 05 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 75- 7. 41 (9H, m), 7. 23 (2H, d, J=8. 7H ż), 4. 36 (1H, m), 4. 00-3. 90 (1H, m), 2. 84 (3H, brs), 2. 40-2. 15 (2 H, m), 2. 10-2. 00 (2H, m), 1. 95-1 . 75 (2H, m), 1. 70-1. 55 (1H, m), 1 . 50-1. 00 (7H, m)
純度 >90%(]	NMR)	
MS 636 (M-	+1)	

実施例番号		332	1H NMR(δ) ppm
но	CI, HCI (H _N	300MHz, DMSO-d6 10. 42 (1H, s), 8. 29 (1H, s), 8. 27 (1H, s), 8. 10 (1H, d, J=7. 9Hz), 8 .03 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 82 (2H, d , J=7. 5Hz), 7. 73 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 56-7. 52 (5H, m), 7. 38 (2H, t , J=7. 9Hz), 7. 26 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 13 (1H, t, J=7. 5Hz), 5. 20 (2 H, s), 4. 35 (1H, br t, J=11. 7Hz), 2. 37-2. 19 (2H, m) , 2. 07-1. 96 (2H, m), 1. 92-1. 79 (2H, m), 1. 69-1. 58 (1H, m), 1. 50-
純度	>90%	(NMR)	1.20 (3H, m)
MS .	656 (M+1)	

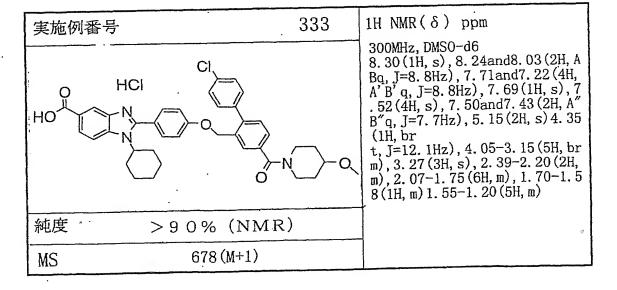


表 221

実施例番号	- 3	34	1H NMR(δ) ppm
НО	CI	ОН	300MHz, DMSO-d6 8. 22 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 01 (1H, d, J=9. 0Hz), 7. 89 (1H, dd, J=8. 6, 1. 5Hz), 7. 61 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 50-7. 39 (4H, m), 7. 27 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 22 (1H, d, J=2. 6Hz), 7. 13 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 04 (1H, dd, J=8. 2, 2. 6Hz), 5. 04 (2H, s), 4. 28 (1H, m), 4. 11 (2H, t, J=6. 3Hz), 3. 57 (2H, t, J=6. 3Hz), 2. 38-2. 17 (2H, m), 2. 00-1. 79 (6H, m), 1. 70-1. 59 (1H, m), 1. 52-1. 16 (3
純度	>90% (NMR)		H, m)
MS	611 (M+1)		

実施例番号	1. 7	335	1H NMR(δ) ppm
НО	HCI CI) О-\ОН	300MHz, DMSO-d6 8. 30 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 27 (1H, d, J=9. 0Hz), 8. 04 (1H, dd, J=8. 6, 1. 5Hz), 7. 72 (2H, d, J=9. 0Hz), 7. 60-7. 40 (4H, m), 7. 32-7. 19 (4H, m), 7. 06 (1H, dd, J=8. 6, 3. 0Hz), 5. 08 (2H, s), 4. 36 (1H, m), 4. 06 (2H, t, J=4. 8Hz), 3. 74 (2H, t, J=4. 8Hz), 2. 38-2. 19 (2H, m), 2. 13-1. 97 (2H, m), 1. 94-1. 78 (2H, m), 1. 72-1. 59 (1H, m), 1. 52-1. 20 (3H, m)
純度	>90% (NM)	R)	20 (313, 111)
MS ·	597 (M+1)		

表222

実施例	HCVポリメラーゼ	実施例	HCVポリメラーゼ
番号	阻害活性ICgo[μΜ]	番号	阻害活性ICgo [μΜ]
340	0.017	360	0. 014
341	0.025	361	0. 028
342	0.015	362	0. 020
343	0.017	363	0. 11
344	0.016	364	0. 12
345	0.012	365	0. 020
346	0. 025	366	0. 024
347	0.022	367	0. 011
348	0.013	368	0.024
349	0.021	369	Ö. 022
350	0.020	370	0.017
351	0.019	371	0. 015
352	0.013	372	0.033
353	0. 023	373	0.013
354	0.013	374	0. 013
355	0.015	375	0. 012
356	0.016	376	0.014
357	0.019	377	0.012
358	0. 017	378	0.018
359	0.015	379	0.021

表223

実施例	HCVポリメラーゼ	実施例	HCVポリメラーゼ
番号	阻害活性 I C 5 0 [μM]	番号	阻害活性IC50[μΜ]
380	0.023	409	0.020
381	0. 011	410	0.018
382	0.015	411	0.015
383	0.013	412	0.019
384	0.016	413	0.026
385	0.019	414	0.024
386	0.018	415	0.019
387	0.025	416	0.024
388	0.020	417	0.029
389	0.012	418	0.016
390	0.014	419	0. 021
391	0.017	420	0.015
392	0. 014	421	0. 017
393	0. 011	422	0. 017
394	0. 019	423	0. 017
395	0.016	424	0. 020
396	0. 025	425	0.026
397	0.037	426	0. 053
398	0. 077	427	0.020
399	0.032	428	0. 026

表224

	28.2		
実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性ΙC ₅₀ [μM]	実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性ΙC ₅₀ [μM]
429	0. 017	455	0. 015
430	0. 017	456	0. 017
431	0. 015	457	0. 015
432	0.022	458	0. 015
433	0. 014	459	0. 014
434	0.011	460	0. 017
435	0.012	461	0. 021
436	0.026	462	0.028
440	0. 070	463	0.026
442	0. 024	464	0. 030
443	0. 030	465	0. 033
445	0.33	466	0. 023
446	0.016	467	0.032
447	0. 12	468	0. 028
448	0.20	469	0.024
449	0. 025	502	0.024
450	0.040	503	0. 196
451	0.031	601	0. 32
452	0. 028	701	0. 052
454	0.013		

実施例番号	3	341
HO	CI	<u> </u>
純度	>90% (NMR)	
MS	662 (M+1)	-

1H NMR(δ) ppm

300MHz, DMSO-d6
8. 29 (1H, d, J=1.5Hz), 8. 25 (1H, d, J=8.7Hz), 8. 03 (1H, dd, J=8.7Hz), 7. 72and7. 22 (4H, Abq, J=8.8Hz), 7. 67 (1H, d, J=1.5Hz), 7. 52 (4H, s), 7. 49 (1H, dd, J=7.9, 1.5Hz), 7. 43 (1H, d, J=7.9Hz), 4. 46 (1H, brs), 4. 35 (1H, brt, J=12.4Hz), 3. 62 (1H, brs), 3. 06 (1H, brs), 2. 79 (1H, brs), 2. 38-2. 20 (2H, brm), 2. 08-1.81 (4H, brm), 1. 77-1. 52 (4H, brm), 1. 46-1. 20 (3H, brm), 1. 19-1. 00 (2H, brm), 0. 94and0. 92 (total3H, each s)

		The second liverage and the second	_
実施例番号	<u>1</u> .	342	
НО	HCI CI		
純度	>90% (NMR))	
MS	679 (M+1)		

1H NMR(δ) ppm

300Mz, DMSO-d6 8. 28 (1H, d, J=1.5Hz), 8. 26 (1H, d, J=1.8Hz), 8. 19 (1H, d, J=8.8Hz), 8. 07 (1H, dd, J=7.7, 1.8Hz), 8. 00 (1H, dd, J=8.8, 1.5Hz), 7. 70 and 7. 22 (4H, Abq, J=8.8Hz), 7. 56-7.50 (1H, m), 7.56 (4H, s), 5. 17 (2H, s), 4. 33 (1H, brt, J=12.5 Hz), 2. 05 (3H, s), 2. 37-2. 20 (2H, brm), 2. 06-1. 80 (4H, brm), 1. 70-1. 60 (1H, brm), 1. 50-1. 20 (3H, brm)

実施例番号	343
HO	CI O NOH
純度	>90% (NMR)
MS	694 (M+1)

1H NMR(δ) ppm

300MHz, DMSO-d6
8. 20 (1H, d, J=1. 5Hz), 7. 93 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 84 (1H, dd, J=8. 3 Hz, 1. 5Hz), 7. 57 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 50-7. 40 (4H, m), 7. 27 (1H, d, J=8. 2Hz), 7. 22 (1H, d, J=2. 6Hz), 7. 10 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 01 (1H, dd, J=8. 6Hz, 2. 6Hz), 5. 02 (2H, s), 4. 89 (2H, s), 4. 78 (1H, d, J=4. 1Hz), 4. 38-4. 18 (1H, m), 3. 96-3. 81 (1H, m), 3. 78-3. 62 (2H, m), 3. 27-2. 99 (2H, m), 2. 35-1. 15 (14H, m)

表 226

実施例番号		344	1H NMR(δ) ppm
но	HCI CI	_Q	300MHz, DMSO-d6 8. 30 (1H, s), 8. 23 (1H, d, J=8. 7H z), 8. 02 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 71 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 55-7. 15 (8H, m), 7. 07 (1H, dd, J=8. 4Hz, 3. 0Hz), 5. 07 (2H, s), 4. 35 (1H, m), 4. 1 7 (2H, t, J=4. 5Hz), 3. 69 (2H, t, J =4. 5Hz), 3. 32 (3H, s), 2. 40-2. 1 5 (2H, m), 2. 10-1. 80 (4H, m), 1. 7 5-1. 60 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m)
純度	>90% (NMR)		
MS	611 (M+1)		

実施例番	号	345	1H NMR(·δ) ppm
но	HCI CI	-00-	300MHz, DMSO-d6 8. 29 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 22 (1H, d, J=8. 7Hz), 8. 01 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 70 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 50-7. 15 (8H, m), 7. 07 (1H, dd, J=8. 4 Hz, 2. 4Hz), 5. 07 (2H, s), 4. 35 (1 H, m), 4. 17 (2H, t, J=4. 2Hz), 3. 76 (2H, t, J=4. 5Hz), 3. 65-3. 40 (4 H, m), 3. 25 (3H, s), 2. 40-2. 20 (2 H, m), 2. 10-1. 80 (4H, m), 1. 75-1. 65 (1H, m), 1. 65-1. 20 (3H, m)
純度	>90% (NMR))	
MS	655 (M+1)		

実施例番号		346	1H NMR(δ) ppm
но	CI N		300Mz, DMSO-d6 8. 26 (1H, d, J=1. 9Hz), 8. 23 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 08-8. 02 (2H, m), 7. 91 (1H, dd, J=8. 7, 1. 5Hz), 7. 6 3and7. 16 (4H, Abq, J=8. 9Hz), 7. 56-7. 51 (5H, m), 5. 15 (2H, s), 4. 29 (1H, brt, J=11. 7Hz), 2. 96 (2H, d, J=6. 9Hz), 2. 37-2. 12 (3H, m), 2. 00-1. 79 (4H, brm), 1. 71-1. 6 0 (1H, brm) 1. 49-1. 19 (3H, brm), 0. 97and0. 95 (total6H, each s)
純度	>90% (NM)	R)	9
MS	621 (M+1)		

表 227

実施例番号	347	1H NMR(δ) ppm
HO N		300Mz, DMSO-d6 8. 26 (1H, s), 8. 22 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 05 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 94and7. 85 (2H, ABq, J=8. 8Hz), 7 .59and7. 15 (4H, A'B'q, J=8. 6Hz), 7. 52 (4H, s), 7. 44 (1H, d, J=8. 0Hz), 5. 12 (2H, s), 4. 27 (1H, brt , J=11. 4Hz), 2. 38-2. 18 (2H, brm), 1. 97-1. 77 (4H, brm), 1. 70-1. 59 (1H, brm), 1. 49-1. 17 (3H, brm)
純度 >90%	(NMR)	
MS 634	(M+1)	

実施例番号		348	1H NMR(δ) ppm
HCI N N	CI 	OH ON OH	300MHz, DMSO-d6 8.32(1H, s), 8.29(1H, d, J=9.0H z), 8.06(1H, d, J=8.7Hz), 7.74(2H, d, J=9.0Hz), 7.72(1H, brs), 7.60-7.45(5H, m), 7.42(1H, d, J =7.8Hz), 7.24(2H, d, J=8.7Hz), 5.15(2H, s), 4.37(1H, m), 4.00- 3.10(6H, m), 2.40-2.18(2H, m), 2.15-1.95(2H, m), 1.90-1.80(2 H, m), 1.75-1.20(6H, m)
純度	> 9 0 %	(NMR)	·
MS	680	(M+1)	

実施例番号 349	1H NMR(δ) ppm
HCI CI HCI N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	300MHz, DMSO-d6 8. 41 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 33 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 26 (1H, d, J=8. 7H z), 8. 18 (1H, dd, J=2. 0Hz, 8. 0Hz), 8. 04 (1H, dd, J=1. 5Hz, 9. 0Hz), 7. 75 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 63 (1H, d, J=8. 1Hz), 7. 62-7. 45 (4H, m), 7. 26 (2H, d, J=8. 7Hz), 5. 25 (2H, s), 4. 35 (1H, m), 2. 45 (3H, s), 2. 40-2. 18 (2H, m), 2. 15-1. 95 (2H, m), 1. 90-1. 80 (2H, m), 1. 75-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m)
純度· >90% (NMR)	55 (In, m), 1.50-1.20 (Sn, m)
MS 619 (M+1)	·

実施例番	믕	350	1H NMR(δ) ppm
HO	HCI CI N O O	0 N H	300MHz, DMSO-d6 8. 36 (1H, d, J=7. 7Hz), 8. 29 (1H, s), 8. 23 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 02 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 94 (1H, d, J=7. 9Hz), 7. 84 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 80-7. 65 (3H, m), 7. 53 (4H, s), 5. 15 (2H, s), 4. 34 (1H, m), 4. 12 (1H, m), 2. 35-2. 20 (2H, m), 2. 10-1. 60 (5H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m), 1. 17 (6H, d, J=6. 5Hz)
純度	>90% (NMR	2)	
MS	622 (M+1)		

実施例番	5号 3	51	1H NMR(δ) ppm
но	HCI CI N N N N N N N N N N N N N N N N N	D	300MHz, DMSO-d6 8. 29 (1H, s), 8. 24 (1H, d, J=8.8H z), 8. 02 (1H, d, J=8.6Hz), 7. 80- 7. 65 (3H, m), 7. 55-7. 45 (5H, m), 7. 32 (1H, d, J=1.5Hz), 7. 22 (2H; d, J=8.8Hz), 5. 13 (2H, s), 4. 35 (1H, m), 3. 60 (2H, m), 3. 33 (2H, m), 2. 40-2. 15 (2H, m), 2. 10-1. 15 (14H, m)
純度	>90% (NMR)		
MS	648 (M+1)		

実施例番号	352	1H NMR(δ) ppm
HO. HCI	CI H N O OH	300MHZ, DMSO-d6 13. 20(1H, brs), 8. 30-8. 24(2H, m), 8. 13(1H, s), 8. 04(1H, d, J=8 .7Hz), 7. 94(1H, d, J=8. 0Hz), 7. 75-7. 70(3H, m), 7. 55-7. 43(5H, m), 7. 25(2H, d, J=8. 7Hz), 5. 13(2H, s), 4. 36(1H, m), 3. 53(2H, s), 2. 40-2. 18(2H, m), 2. 15-1. 95(2H, m), 1. 90-1. 80(2H, m), 1. 75-1. 55(1H, m), 1. 50-1. 20(9H, m)
純度 >90	% (NMR)	. *
MS . 6	552 (M+1)	

表 229

実施例番号	353	1H NMR(δ) ppm
2HCl		300MHz, DMSO-d6 8. 41 (1H, s), 8. 33-8. 29 (2H, m), 8. 16 (1H, d, J=8. 2Hz), 8. 07 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 77 (2H, d, J=8. 7H z), 7. 62 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 59- 7. 51 (4H, m), 7. 28 (2H, d, J=8. 8H z), 5. 21 (2H, s), 4. 56 (2H, s), 4. 37 (1H, m), 2. 40-2. 18 (2H, m), 2. 15-1. 95 (2H, m), 1. 90-1. 80 (2H, m), 1. 75-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 2 0 (9H, m)
純度 約90%	(NMR)	
MS 634	(M+1)	

実施例番号	354	1H NMR(δ) ppm
HCI N N	CI N OH	300MHz, DMSO-d6 8. 31 (1H, s), 8. 25 (1H, d, J=9. 0H z), 8. 03 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 76- 7. 71 (3H, m), 7. 51-7. 47 (5H, m), 7. 33 (1H, s), 7. 23 (2H, d, J=9. 0H z), 5. 14 (2H, s), 4. 36 (1H, m), 4. 02 (1H, m), 3. 75 (1H, m), 3. 56 (1H , m), 3. 22 (2H, m), 2. 40-2. 18 (2H , m), 2. 15-1. 95 (2H, m), 1. 90-1. 55 (5H, m), 1. 50-1. 20 (5H, m)
純度 > 9	0% (NMR)	
MS	664 (M+1)	

実施例番号	355	1H NMR(δ) ppm
HCI CI)О NОН	300MHz, DMSO-d6 8. 62 (1H, t, J=5. 7Hz), 8. 32-8. 3 0 (2H, m), 8. 25 (1H, d, J=8. 7Hz), 8. 03 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 96 (1H, d, J=8. 1Hz), 7. 86 (1H, s), 7. 75 (1H, d, J=9. 0Hz), 7. 72 (2H, d, J=9 . 0Hz), 7. 55-7. 50 (4H, m), 7. 22 (2H, d, J=9. 0Hz), 5. 17 (2H, s), 4. 35 (1H, m), 3. 52 (2H, t, J=6. 0Hz) , 3. 36 (2H, t, J=6. 0Hz), 2. 40-2. 18 (2H, m), 2. 15-1. 95 (2H, m), 1. 90-1. 80 (2H, m), 1. 75-1. 55 (1H,
純度. >90% (NI	AR)	m), 1. 50-1. 20 (3H, m)
MS 624 (M+1)		

表 230

実施例番号	356	1H NMR(δ) ppm
HON	CI NH NH	300Mz, DMSO-d6 9. 30 (1H, t, J=5. 9Hz), 8. 54 (2H, d, J=5. 9Hz), 8. 22 (1H, s), 8. 02-7. 79 (5H, m), 7. 59 and 7. 12 (4H, A Bq, J=8. 6Hz), 7. 55 (4H, s), 7. 37 (2H, d, J=5. 9Hz), 5. 15 (2H, s), 4. 54 (2H, d, J=5. 7Hz), 4. 26 (1H, b rt, J=12. 8Hz), 2. 36-2. 18 (2H, b rm), 1. 97-1. 78 (4H, brm), 1. 70-1. 60 (1H, brm), 1. 47-1. 17 (3H, b rm)
純度 >90	% (NMR)	
MS 6	671 (M+1)	

実施例番号	357	1H NMR(δ) ppm
HCI CI N O		300Mz, DMSO-d6 8. 31 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 43 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 03 (1H, dd, J=8. 4, 1. 5Hz), 7. 74 (1H, d, J=8. 1Hz), 7. 73 and 7. 23 (4H, ABq, J=9. 0Hz), 7. 54-7. 51 (5H, m), 7. 37 (1H, d, J=1. 8Hz), 5. 14 (2H, s), 4. 36 (1H, brt, J=12. 1Hz), 2. 98 (6H, brs), 2. 37-2. 20 (2H, brm), 2. 08-1. 8 1 (4H, brm), 1. 70-1. 60 (1H, brm), 1. 50-1. 21 (3H, brm)
純度 >90%(NMR)	
MS 608 (M	+1)	

実施例番号		358	1H NMR(δ) ppm
HO N		N S NH ₂	300MHz, DMSO-d6 8. 33 (1H, s), 8. 31 (1H, d, J=8. 7H z), 8. 14 (1H, s), 8. 07 (1H, d, J=8 . 7Hz), 7. 92 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 76 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 52-7. 40 (5H, m), 7. 31-7. 26 (3H, m), 5. 15 (2H, s), 4. 37 (1H, m), 2. 40-2. 18 (2H, m), 2. 15-1. 95 (2H, m), 1. 90-1. 80 (2H, m), 1. 75-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m)
純度·	約90%(NMR)	
MS	635 (M	+1)	

表 231

実施例番号		359	1H NMR(δ) ppm
HOTH	HCI CI	S-N-OH	300MHz, DMSO-d6 8. 31 (1H, s), 8. 25 (1H, d, J=8. 7H z), 8. 10-7. 90 (2H, m), 7. 82 (1H, dd, J=7. 8Hz, 1. 8Hz), 7. 72 (2H, d , J=9. 0Hz), 7. 63 (1H, d, J=8. 1Hz), 7. 23 (2H, d, J=9. 0Hz), 5. 25 (2 H, s), 4. 34 (1H, m), 3. 65-3. 50 (1 H, m), 3. 20-3. 05 (2H, m), 2. 90-2 . 75 (2H, m), 2. 40-2. 15 (2H, m), 2 . 10-1. 10 (12H. m)
純度	> 9 0 %	(NMR)	
MS	700	(M+1)	

実施例番	号	360	1H NMR(δ) ppm
НО	HCI F	O N	300MHz, DMSO-d6 8.33(1H, s), 8.30(1H, d, J=8.5H z), 8.06(1H, d, J=10.1Hz), 8.80 -8.65(3H, m), 8.60-8.45(3H, m), 7.42(1H, d, J=7.8Hz), 7.35-7. 15(4H, m), 5.15(2H, s), 4.36(1H, m), 3.01, 2.97(6H, s), 2.40-2. 15(2H, m), 2.10-1.75(4H, m), 1.70-1.55(1H, m), 1.50-1.20(3H, m)
純度	>90% (NM	IR)	
MS	592 (M+1)		

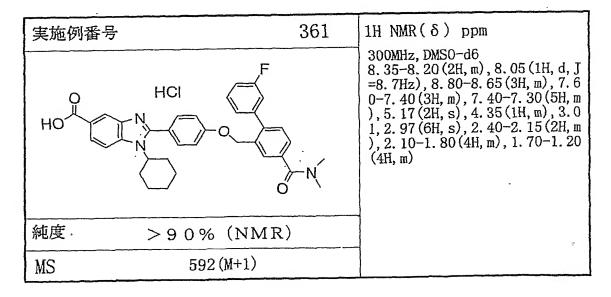
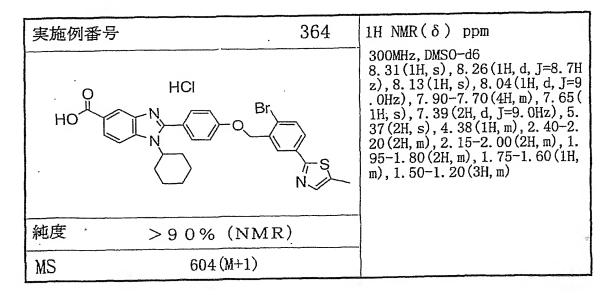


表 232

実施例番号 362	1H NMR(δ) ppm
HCI S HO N N N	300MHz, DMSO-d6 8. 33 (1H, s), 8. 29 (1H, d, J=8. 7H z), 8. 06 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 79 (2H, d, J=9. 0Hz), 7. 76 (1H, d, J=9 .0Hz), 7. 60 (1H, d, J=8. 1Hz), 7. 53 (1H, dd, J=1. 7Hz, 8. 0Hz), 7. 3 5 (2H, d, J=8. 7Hz), 6. 85-6. 80 (2 H, m), 5. 29 (2H, s), 4. 38 (1H, m), 3. 01, 2. 96 (6H, s), 2. 40-2. 18 (2 H, m), 2. 15-1. 95 (2H, m), 1. 90-1 .80 (2H, m), 1. 75-1. 55 (1H, m), 1 .50-1. 20 (3H, m)
純度 >90% (NMR)	. 50-1. 20 (311, 11)
MS 614 (M+1)	

実施例番号		363	1H NMR(δ) ppm
HO	HCI Br	-O N	300MHz, DMSO-d6 8. 28 (1H, d, J=1. 3Hz), 8. 20-8. 1 0 (2H, m), 8. 98 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 90-7. 80 (2H, m), 7. 75 (2H, d, J =8. 7Hz), 7. 36 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 04 (1H, d, J=1. 3Hz), 5. 35 (2H, s), 4. 36 (1H, m), 2. 39 (3H, s), 2. 35-2. 15 (2H, m), 2. 05-1. 75 (4H, m), 1. 70-1. 60 (1H, m), 1. 50-1. 2 0 (3H, m)
純度 >	90% (NMR)		
MS	586 (M+1)		



実施例番	무	365	1H NMR(δ) ppm
но	HCI N N	O N	300MHz, DMSO-d6 8. 28(1H, s), 8. 23(1H, s), 8. 17(1H, d, J=8. 7Hz), 8. 00(2H, t, J=6 .9Hz), 7. 69(2H, d, J=8. 4Hz), 7. 60-7. 45(5H, m), 7. 21(2H, d, J=8 .4Hz), 7. 05(1H, s)5. 19(2H, s), 4. 33(1H, m), 2. 41(3H, s), 2. 40- 2. 20(2H, m), 2. 10-1. 80(4H, m), 1. 70-1. 60(1H, m), 1. 50-1. 20(3 H, m)
純度	> 9 0 %	(NMR)	
MS	618 (1	M+1)	·

実施例番号		366	1H NMR(δ) ppm
НО	HCI CI	S N	300MHz, DMSO-d6 8. 26(1H, s), 8. 17(1H, s), 8. 11(1H, d, J=8. 7Hz), 7. 95(2H, d, J=9.6Hz), 7. 70-7. 40(8H, m), 7. 19(2H, d, J=8. 4Hz), 5. 18(2H, s), 4. 30(1H, m), 2. 51(3H, s), 2. 40-2. 15(2H, m), 2. 05-1. 80(4H, m), 1. 75-1. 60(1H, m), 1. 50-1. 20(3H, m)
純度	>90% (NM)	R)	
MS	634 (M+1)		

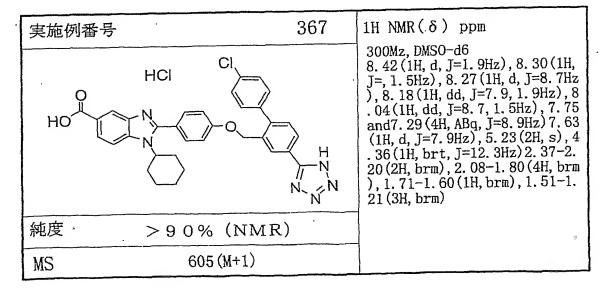
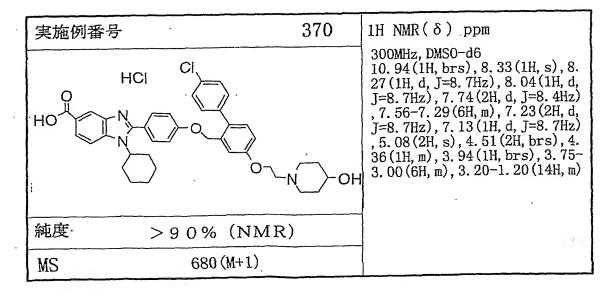


表 234

実施例番号	368	1H NMR(δ) ppm
HCI O HO N	N CI	300Mz, DMSO-d6 8. 30(1H, d, J=1.5Hz), 8. 25(1H, d, J=8.6Hz), 8. 04(1H, dd, J=8.6 , 1. 5Hz), 7. 93and7. 67(4H, ABq, J=8.1Hz), 7. 80(1H, d, J=2.2Hz), 7. 72and7. 21(4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7. 60(1H, dd, J=8.1, 2.2Hz), 7. 44(1H, d, J=8.1Hz), 5. 13(2H, s), 4. 34(1H, brt, J=11.7Hz), 2. 37-2. 19(2H, brm), 2. 09-1. 80(4H, brm), 1. 72-1. 60(1H, brm), 1. 50-1. 21(3H, brm)
純度 > 9	0% (NMR)	. 50 1. 21 (511, 51111)
MS	562 (M+1)	

実施例番号		369	1H NMR(δ) ppm
но	HCI N NH	CI	300Mz, DMSO-d6 8. 30(1H, d, J=1.5Hz), 8. 25(1H, d, J=8.6Hz), 8. 16and7. 72(4H, A Bq, J=8.4Hz), 8. 13(1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7. 80(1Hd, J=2.2Hz), 7. 70and7. 24(4H, A'B'q, J=8.8Hz), 7. 61(1H, dd, J=8.1, 2.2Hz), 7. 48(1H, d, J=8.1Hz), 5. 17(2H, s), 4. 33(1H, brt, J=12.1Hz), 2. 36-2.18(2H, brm), 2.08-1.77(4H, brm), 1.69-1.57(1H, brm), 1.49-1.17(3H, brm)
純度	> 9 0 % (NMR)		75 1. 11 (OII, 51 III)
MS	605 (M+1)		



実施例番号	371	1H NMR(δ) ppm
HCI HO N	CI N-O	300MHz, DMSO-d6 8. 31 (1H, d, J=1.5Hz), 8. 17 (1H, d, J=9.0Hz), 7. 99 (1H, dd, J=8.7 Hz, 1.4Hz), 7. 70-7. 55 (2H, m), 7. 50-7. 30 (6H, m), 7. 19 (1H, dd, J=12.0Hz, 2.2Hz), 7. 06 (1H, dd, J=8.6Hz, 2.2Hz), 5. 08 (2H, 4.10 (1H, m), 3. 68 (2H, brt, J=5.2), 2. 50 (2H, brt, J=1.8Hz), 2. 30-2. 10 (2H, m), 2. 00-1. 75 (8H, m), 1. 70-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m)
純度 > 9	90% (NMR)) -
MS	652 (M+1)	

実施例番	号	372	1H NMR(δ) ppm
но	HCI F N O	Ci	300Mz, DMSO-d6 8. 29 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 11 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 96 (1H, dd, J=8. 6, 1. 5Hz), 7. 89 (1H, s), 7. 78 and 7. 56 (4H, ABq, J=8. 4Hz), 7. 69 (1H, s), 7. 66 (1H, t, J=8. 8Hz), 7. 31 (1H, dd, J=12. 1, 2. 2Hz), 7. 18 (1H, dd, J=8. 8, 2. 2Hz), 5. 37 (2H, s), 4. 08 (1H, brt, J=11. 0Hz), 3. 02 (3H, s), 2. 96 (3H, s), 2. 31-2. 14 (2H, brm), 1. 95-1. 77 (4H, brm, 1. 69-1. 59 (31H, brm), 1. 46-1.
純度	>90% (NMR)	18 (3H, brm)
MS	626 (M	+1)	

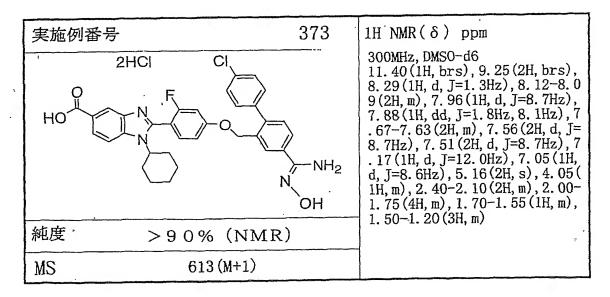
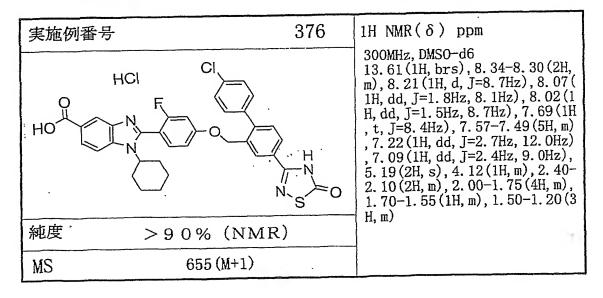


表 236

実施例番	号	374	1H NMR(δ) ppm
но	HCI F O	HZ O	300MHz, DMSO-d6 13. 21 (1H, brs), 8. 31 (1H, d, J=1 .4Hz), 8. 18-8. 15 (2H, m), 7. 99 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 94 (1H, dd, J= 1. 8Hz, 8. 0Hz), 7. 70-7. 53 (6H, m), 7. 17 (1H, d, J=12. 0Hz), 7. 05 (1H, d, J=8. 6Hz), 5. 20 (2H, s), 4. 09 (1H, m), 2. 40-2. 10 (2H, m), 2. 00-1. 75 (4H, m), 1. 70-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m)
純度	>90% (NM)	R)	
MS	639 (M+1)		

実施例番号	. 375	1H NMR(δ) ppm
HCI F. O	H N S O	300MHz, DMSO-d6 8. 32 (1H, d, J=1.5Hz), 8. 23 (1H, d, J=1.5Hz), 8. 19 (1H, d, J=9.0Hz), 8. 03-7.98 (2H, m), 7. 68 (1H, t, J=8.4Hz), 7. 60 (1H, d, J=8.1Hz), 7. 56 (2H, d, J=9.3Hz), 7. 53 (2H, d, J=9.0Hz), 7. 22 (1H, dd, J=2.1Hz, 12.0Hz), 7. 09 (1H, dd, J=2.1Hz, 8.4Hz), 5. 21 (2H, s), 4. 12 (1H, m), 2. 40-2. 10 (2H, m), 2. 00-1.75 (4H, m), 1. 70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度 >90%(NMR)), 1. 00 1. 20 (Oil, ai)
MS 658 (M	+1)	



実施例	番号 3	77
о но .	HCI F O	HN
純度	>90% (NMR)	
MS	638 (M+1)	
L.		

300Mz, DMSO-d6
8. 60 (1H, d, J=4. 5Hz), 8. 29 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 14 (1H, d, J=8. 9H z), 8. 13 (1H, d, J=1. 5Hz), 7. 98 (1H, dd, J=8. 9, 1. 5Hz), 7. 94 (1H, dd, J=8. 1, 1. 5Hz), 7. 64 (1H, t, J=8. 7Hz), 7. 52and7. 49 (4H, ABq, J=9. 0Hz), 7. 46 (1H, d, J=8. 1Hz), 7. 18 (1H, dd, J=12. 1, 2. 3Hz), 7. 05 (1H, dd, J=8. 7, 2. 3Hz), 5. 13 (2H, s), 4. 08 (1H, brt, J=12. 1H), 2. 95-2. 84 (1H, m), 2. 31-2. 14 (2H, brm), 1. 97-1. 78 (4H, brm), 1. 72-1. 59 (1H, brm), 1. 47-1. 21 (3H, brm), 0. 76-0. 58 (4H, m)

実施例番号	<u>1</u>	378
НО	HCI F O	» → N)
純度	>90% (NMR)
MS	652 (M+1)	

1H NMR(δ) ppm

300Mz, DMSO-d6 8.77(1H, d, J=1.4Hz), 8.30(1H, d, J=1.4Hz), 8.16(1H, d, J=1.8Hz), 8.13(1H, d, J=8.4Hz), 7.98(2H, dd, J=8.4, 1.8Hz), 7.65(1H, t, J=8.4Hz), 7.53and7.49(4H, ABq, J=8.8Hz), 7.47(1H, d, J=7.7Hz), 7.18(1H, dd, J=12.1, 2.2Hz), 7.05(1H, dd, J=8.4, 2.2Hz), 5.13(2H, s), 4.53-4.40(1H, m), 4.09(1H, brt, J=12.8Hz), 2.31-2.02(6H, brm,), 1.96-1.80(4H, brm), 1.78-1.60(3H, brm), 1.47-1.21(3H, brm)

実施例番号	17	379
но	HCI F O	-N
純度·	>90% (NMR)	
MS	654 (M+1)	

1H NMR(δ) ppm

300Mz, DMSO-d6 8. 29 (1H, d, J=1.1Hz), 8. 11 (1H, d, J=8.8H z), 7. 98-7. 91 (2H, m), 7. 89 (1H, s), 7. 63 (1H, t, J=8.8Hz), 7. 52a nd7. 48 (4H, ABq, J=8.6Hz), 7. 44 (1H, d, J=8.1Hz), 7. 17 (1H, dd, J=12.1, 2. 2Hz), 7. 04 (1H, dd, J=8.8, 2. 2Hz), 5. 12 (2H, s), 4. 07 (1H, brt, J=12.4Hz), 2. 33-2. 14 (2H, brm), 1. 96-1. 79 (4H, brm), 1. 70-1. 60 (1H, brm), 1. 48-1. 21 (3H, brm), 1. 41 (9H, s)

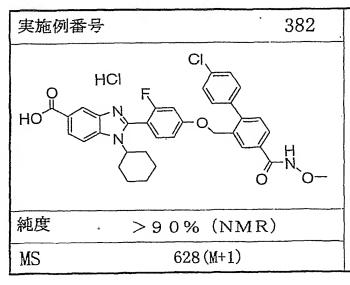
実施	列番号 380
НО	HCI F O H
純度	>90% (NMR)
MS	654 (M+1)

300Mz, DMSO-d6
8.62(1H, t, J=5.5Hz), 8.30(1H, d, J=1.5Hz), 8.17(1H, d, J=1.8Hz), 8.14(1H, d, J=8.8Hz), 7.98(1H, dd, J=8.1, 1.8Hz), 7.64(1H, t, J=8.8Hz), 7.52and7.50(4H, ABq, J=8.8Hz), 7.48(1H, d, J=8.1Hz), 7.18(1H, dd, J=12.1, 2.2Hz), 7.05(1H, dd, J=8.8, 2.2Hz), 5.14(2H, s), 4.08(1H, brt, J=12.1Hz), 3.13(1H, t, J=6.2Hz), 2.31-2.14(2H, brm), 1.97-1.78(5H, brm), 1.70-1.60(1H, brm), 1.47-1.21(3H, brm), 0.92(3H, s), 0.90(3H, s)

実施例番号		381
НО	CI	У он
純度	>90% (NMR)	-
MS	656 (M+1)	

1H NMR(δ) ppm

300Mz, DMSO-d6
8. 29(1H, d, J=1. 5Hz), 8. 27(1H, d, J=8. 3Hz), 8. 18(1H, d, J=1. 9Hz), 8. 13(1H, d, J=8. 7Hz), 8. 01-7. 96(2H, m), 7. 64(1H, t, J=8. 7Hz), 7. 52and7. 49(1H, ABq, J=8. 8Hz), 7. 49(1H, d, J=7. 9Hz), 7. 18(1H, dd, J=12. 1, 2. 3Hz), 7. 05(1H, dd, J=8. 7, 2. 3Hz), 5. 13(2H, s), 4. 12-4. 00(2H, m), 3. 52-3. 34(2H, m), 2. 31-2. 14(2H, brm), 1. 97-1. 79(4H, brm), 1. 71-1. 60(1H, brm), 1. 48-1. 21(3H, m), 1. 17 and1. 15(total3H, each s)



1H NMR(δ) ppm

300Mz, DMSO-d6 8. 30 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 13 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 09 (1H, d, J=1. 5Hz), 7. 98 (1H, dd, J=8. 8, 1. 5Hz), 7. 86 (1H, dd, J=8. 1, 1. 5Hz), 7. 6 4 (1H, J=8. 8Hz), 7. 55-7. 47 (5H, m), 7. 17 (1H, dd, J=12. 1, 2. 2Hz), 7. 05 (1H, dd, J=8. 8, 2. 2Hz), 5. 14 (2H, s), 4. 08 (1H, brt, J=12. 8 Hz), 3. 75 (3H, s), 2. 32-2. 14 (2H, brm), 1. 96-1. 78 (4H, brm), 1. 7 0-1. 59 (1H, brm), 1. 47-1. 21 (3H, brm)

実施例番号	38	3	1 F
HCI O HO N	CI F N	OH	30 8 d z 7 z H (H) 0
純度	>90% (NMR)		(
MS	672 (M+1)		()

300Mz, DMSO-d6
8. 57 (1H, t, J=5. 5Hz), 8. 29 (1H, d, J=1. 4Hz), 8. 19 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 12 (1H, d, J=9. 2Hz), 8. 01-7. 95 (2H, m), 7. 64 (1H, t, J=8. 8Hz), 7. 53 and 7: 50 (4H, ABq, J=8. 8Hz), 7. 48 (1H, d, J=7. 7Hz), 7. 17 (1H, dd, J=12. 1, 2. 2Hz), 7. 04 (1H, dd, J=8. 8, 2. 2Hz), 5. 14 (2H, s), 4. 08 (1H, brt, J=13. 9Hz), 3. 7 0-3. 66 (1H, m), 3. 48-3. 36 (3H, m), 3. 28-3. 20 (1H, m), 2. 32-2. 13 (2H, brm), 1. 96-1. 79 (4H, brm), 1. 71-1. 60 (1H, brm), 1. 47-1. 19 (3H, brm)

実施例番号		384
но	HCI F O	N
純度	>90% (NN	AR)
MS	640 (M+1)	

1H NMR(δ) ppm

300Mz, DMSO-d6
8. 30(1H, d, J=1.5Hz), 8. 14(1H, d, J=8.4Hz), 7. 98(1H, dd, J=8.4, 1.5Hz), 7. 68(1H, brs), 7. 63(1H, t, J=8.4Hz), 7. 51(5H, s), 7. 43(1H, d, J=8.1Hz), 7. 17(1H, dd, J=12.5, 1.8Hz), 7. 03(1H, dd, J=8.4, 1.8Hz), 4. 08(1H, brt, J=11.4Hz), 3. 50and3. 30(total2H, each brs), 2. 97(3H, brs), 2. 33-2. 13(2H, brm), 1. 96-1. 79(4H, brm), 1. 70-1. 59(1H, brm), 1. 47-1. 03(6H, brm),

実施	西例番号	385	1H NMR
H	HCI CI) N_	300Mz, l 8. 29 (11 d, J=8. 3 , 1. 5Hz), 5-7. 42 . 7Hz), 15 (2H, 3 Hz), 3. 4 h s), 2. 9 H, brm), 47-1. 2
純度	₹ · . >90% (NM	R)	(total)
MS	654 (M+1)		

LH NMR(δ) ppm

300Mz, DMSO-d6
8. 29 (1H, d, J=1.5Hz), 8. 12 (1H, d, J=8.8Hz), 7. 97 (1H, dd, J=8.8, 1.5Hz), 7. 72-7.60 (2H, m), 7. 5
5-7. 42 (6H, m), 7. 16 (1H, d, J=11.7Hz), 7. 03 (1H, d, J=8.4Hz), 5. 15 (2H, s), 4. 07 (1H, brt, J=12.5 Hz), 3. 44and3. 22 (total2H, each s), 2. 97 (3H, brs), 2. 32-2. 13 (2 H, brm), 1. 72-1.50 (3H, brm), 1. 47-1.23 (3H, brm), 0. 93and0.72 (total3H, each brs)

実施例都	香号	386	1H NMR(δ) ppm
HO	HCI E O		300Mz, DMSO-d6 8. 29 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 12 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 97 (1H, dd, J=8. 7, 1. 5Hz) 7. 74-7. 60 (2H, m), 7. 54 -7. 42 (6H, m), 7. 17 (1H, dd, J=12 .1, 2. 2Hz), 7. 02 (1H, dd, J=8. 3, 2. 2Hz), 5. 15 (2H, s), 4. 06 (1H, b rt, J=12. 8Hz), 3. 92 (1H, brs), 2 .85 (3H, brs), 2. 32-2. 14 (2H, br m), 1. 96-1. 79 (4H, brm), 1. 70-1 .59 (1H, brm), 1. 46-1. 07 (3H, br m), 1. 15 (6H, brs)
純度	> 9 0 % (NM	1R)	
MS	654 (M+1)		

実施例番号		3	87	1H NMR(δ) ppm
HCI O HO N	CI F. O	NO N		300Mz, DMSO-d6 8. 29(1H, s), 8. 14and7. 97(2H, A) Bq, J=8. 7Hz), 7. 63(1H, s), 7. 63 (1H, t, J=8. 7Hz), 7. 51-7. 41(6H, m), 7. 16(1H, dd, J=12. 1, 1. 9Hz), 7. 02(1H, dd, J=8. 7, 1. 9Hz), 5. 16(2H, s), 4. 26(2H, brs), 4. 07 (1H, brt, J=12. 1Hz), 2. 32-2. 14 (2H, brm), 1. 97-1. 78(5H, brm)1 .70-1. 15(9H, brm), 1. 24(3H, s) ,1. 21(3H, s)
純度	>90% (N	IMR)		
MS	694 (M+	1)		

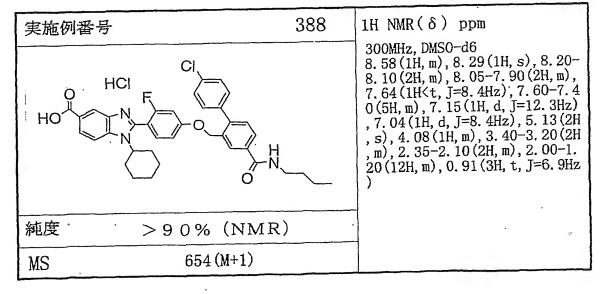


表 241

実施例番号	389	
HCI HO N	CI F O H N	300MHz, DMSO-d6 8.60(1H, m), 8.29(1H, s), 8.20- 7.90(4H, m), 7.64(1H, t, J=9.0H z), 7.60-7.40(5H, m), 7.17(1H, d, J=12.0Hz), 7.04(1H, d, J=8.7 Hz), 5.13(2H, s), 4.80(1H, m), 3 .35-3.15(2H, m), 2.30-2.05(2H, m), 2.00-1.10(10H, m), 0.91(3 H, t, J=7.5Hz)
純度 >	90% (NMR)	
MS	640 (M+1)	

実施例番号		390	1H NMR(δ) ppm
НО	CI CI N N N O O	ZZ_	300MHz, DMSO-d6 8.62(1H, m), 8, 30(1H, s), 8.20- 8.10(2H, m), 8.05-7.90(2H, m), 7.65(1H, t, J=8.4Hz), 7.60-7.4 0(5H, m), 7.18(1H, d, J=12.0Hz), 7.05(1H, d, J=8.4Hz), 5.14(2H, s), 4.09(1H, m), 3.40-3.20(2H, m), 2.35-2.10(2H, m), 2.00-1. 80(4H, m), 1.75-1.60(1H, m), 1.45-1.20(3H, m), 1.15(3H, t, J=7.2Hz)
純度	>90% (NMR)		
MS	626 (M+1)		

実施例番号	391	1H NMR(δ) ppm
HCI F O	N N N	400NHz, DMSO-d6 8.54(1H, s), 8.31(1H, s), 8.19(1H, d, J=8.6Hz), 8.01(1H, d, J=8.6Hz), 7.81(1H, d, J=2.1Hz), 7.64(1H, t, J=8.4Hz), 7.61(1H, dd, J=2.3Hz, 8.4Hz), 7.47(2H, d, J=8.6Hz), 7.43(2H, d, J=8.8Hz), 7.25(1H, d, J=8.4Hz), 7.17(1H, dd, J=2.3Hz, 12.1Hz), 7.05(1H, dd, J=2.3Hz, 8.6Hz), 5.05(2H, s), 4.12(1H, m), 2.96(6H, s), 2.40-2.10(2H, m), 2.00-1.75(4H, m)
純度· >90% (N	MR)), 1.70-1.55(1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
MS 641 (M+1)	,

実施例番	号 392
НО	HCI F O N O O
純度	>90% (NMR)
MS	683 (M+1)

300Mz, DMSO-d6
8. 79 (1H, s), 8. 29 (1H, d, J=1. 5H z), 8. 13 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 98 (1H, dd, J=8. 8, 1. 5Hz), 7. 80 (1H, d, J=2. 2Hz), 7. 63 (1H, t, J=8. 4H z), 7. 61 (1H, dd, J=8. 2, 2. 2Hz), 7. 47 and 7. 43 (4H, ABq, J=8. 8Hz), 7. 26 (1H, d, J=8. 2Hz), 7. 14 (1H, dd, J=12. 1, 2. 2Hz), 7. 02 (1H, dd, J=8. 4, 2. 2Hz), 5. 05 (2H, s), 4. 08 (1H, brt, J=12. 1Hz), 3. 64-3. 61 (2H, m), 3. 48-3. 45 (2H, m), 2. 32-2. 13 (2H, brm), 1. 96-1. 78 (4H, brm), 1. 70-1. 66 (1H, brm), 1. 44-1. 19 (3H, brm)

·実施例番	号	393
НО	HCI F	N-NH ₂
純度	> 9 0 %	(NMR)
MS	613 ((M+1)

1H NMR(δ) ppm

400MHz, DMSO-d6 8. 94 (1H, s), 8. 31 (1H, d, J=1. 0H z), 8. 18 (1H, d, J=8. 6Hz), 8. 00 (1H, dd, J=1. 4Hz, 8. 8Hz), 7. 71 (1 H, d, J=2. 2Hz), 7. 66 (1H, t, J=8. 6Hz), 7. 52 (1H, dd, J=2. 4Hz, 8. 6 Hz), 7. 46 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 42 (2H, d, J=8. 2Hz), 7. 24 (1H, d, J= 8. 4Hz), 7. 16 (1H, d, J=12. 1Hz), 7. 04 (1H, dd, J=2. 4Hz, 8. 8Hz), 5 .05 (2H, s), 4. 13 (1H, m), 2. 40-2 .10 (2H, m), 2. 00-1. 75 (4H, m), 1 .70-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m)

実施例番号	号 394
но	HCI F O N N N N N N N N N N N N N N N N N N
純度	> 9 0 % (NMR)
MS	641 (M+1)

1H NMR(δ) ppm

300MHz, DMSO-d6 8. 93 (1H, s), 8. 31 (1H, d, J=1. 4H z), 8. 19 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 01 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 71 (1H, d, J=2 .2Hz), 7. 66 (1H, t, J=8. 5Hz), 7. 51 (1H, dd, J=2. 2Hz, 8. 4Hz), 7. 4 6 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 41 (2H, d, J =8. 7Hz), 7. 23 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 16 (1H, d, J=12. 2Hz), 7. 05 (1H ,d, J=8. 7Hz), 5. 05 (2H, s), 4. 13 (1H, m), 3. 12 (2H, q, J=7. 2Hz), 2 .40-2. 10 (2H, m), 2. 00-1. 75 (4H ,m), 1. 70-1. 60 (1H, m), 1. 55-1. 20 (3H, m), 1. 06 (3H, t, J=7. 2Hz)

表 243

実施例	番号	395	1H NMR(δ)
HO	HCI F O		300MHz, DMSO- 8.83(1H, s), 8 z), 8.21(1H, c 1H, dd, J=1.4F H, d, J=2.1Hz) 6Hz), 7.49(1F Hz), 7.46(2H, (2H, d, J=8.6F 8.4Hz), 7.17(7.06(1H, d, J= brs), 5.05(2F 3.77(1H, sept
純度	>90% (NM	R)	2. 10 (2H, m), 2 1. 70-1. 55 (1H
MS	655 (M+1)		H, m), 1.11 (6H

300MHz, DMS0-d6 8.83(1H, s), 8.32(1H, d, J=1.4H z), 8.21(1H, d, J=8.8Hz), 8.02(1H, dd, J=1.4Hz, 8.7Hz), 7.71(1 H, d, J=2.1Hz), 7.68(1H, t, J=8.6Hz), 7.49(1H, dd, J=2.2Hz, 8.4 Hz), 7.46(2H, d, J=8.4Hz), 7.41 (2H, d, J=8.6Hz), 7.23(1H, d, J=8.4Hz), 7.17(1H, d, J=12.2Hz), 7.06(1H, d, J=8.7Hz), 6.30(1H, d, J=8.7Hz), 6.4(1H, d, J=12.2Hz),

ppm

brs), 5. 05 (2H, s), 4. 14 (1H, m), 3. 77 (1H, sept, J=6.5Hz), 2. 40-2. 10 (2H, m), 2. 00-1. 75 (4H, m), 1. 70-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3 H, m), 1. 11 (6H, d, J=6.5Hz)

 実施例番号
 396

 HO
 N

 N
 F

 F
 F

 N
 N

 ARE
 > 90% (NMR)

 MS
 642 (M+1)

1H NMR(δ) ppm

300MHz, DMSO-d6 8. 37 (1H, d, J=7. 3Hz), 8. 25 (1H, s), 8. 15 (1H, s), 7. 97 (2H, d, J=8. 8Hz), 7. 88 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 58-7. 47 (4H, m), 7. 31 (1H, m), 7. 11 (1H, dd, J=8. 4, 2. 2Hz), 6. 98 (1H, dd, J=8. 4, 2. 2), 5. 13 (2H, s), 4. 13 (1H, q, J=6. 6Hz), 3. 98 (1H, m), 2. 19 (2H, m); 1. 86 (4H, m) 1. 62 (1H, m) 1. 31 (3H, m), 1. 20 (6H, d, J=6. 6Hz)

実	例番号 3	97
	HCI F F	>
純	>90% (NMR)	
MS	642 (M+1)	

1H NMR(δ) ppm

300MHz, DMSO-d6 8. 40 (1H, d, J=7. 9Hz), 8. 28 (1H, d, J=1. 9Hz), 8. 15 (1H, d, J=1. 9Hz), 8. 11 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 96 (2H, m), 7. 56 (1H, t, J=8. 7Hz), 7. 45 (3H, m), 7. 18 (1H, m), 7. 08 (1H, dd, J=12. 1, 1. 9Hz), 6. 96 (1H, dd, J=8. 3, 2. 3Hz), 5. 09 (2H, s), 4. 14 (1H, m), 4. 04 (1H, m), 2. 23 (2H, m), 1. 86 (3H, m), 1. 62 (1H, m), 1. 33 (3H, m), 1. 20 (6H, d, J=6. 4Hz)

表 244

実施例番号	398	1H NMR(δ) ppm
HCI CI N F CI N.	HN O	8. 41 (1H, d, J=8. 1Hz), 8. 29 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 17 (1H, d, J=1. 8Hz), 8. 12 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 01-7. 95 (2H, m), 7. 67-7. 62 (2H, m), 7. 55-7. 51 (3H, m), 7. 19 (1H, dd, J=12. 1, 2. 2Hz), 7. 05 (1H, dd, J=8. 8, 2. 2Hz), 5. 13 (2H, s), 4. 10-4. 00 (2H, m), 2. 32-2. 13 (4H, m), 1. 71-1. 60 (1H, m), 1. 49-1. 14 (3H, m), 1. 21 (3H, s), 1. 19 (3H, s)
純度 > 90% (NM)	R)	
MS 674 (M+1)		

実施例番号	39	99	1H NMR(δ) ppm
HCI O HO N	F CI	-	300Mz, DMSO-d6 8. 39 (1H, d, J=7. 7Hz), 8. 29 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 16 (1H, d, J=1. 8Hz), 8. 10 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 00-7. 95 (2H, m), 7. 69-7. 61 (2H, m), 7. 54-7. 46 (3H, m), 7. 18 (1H, dd, J=12. 1, 2. 2Hz), 7. 04 (1H, dd, J=8. 8, 2. 2Hz), 5. 13 (2H, s), 4. 20-4. 02 (2H, m), 2. 33-2. 13 (2H, brm), 1. 97-1. 80 (4H, m), 1. 72-1. 61 (1H, m), 1. 44-1. 13 (3H, m), 1. 21 (3H, s), 1. 19 (3H, s)
純度 >	90% (NMR)		(511, 57, 1. 17 (511, 57
MS	658 (M+1)		

実施例番号	400	1H NMR(δ) ppm
но	CI CI N N N N N N N N N N N N N N N N N	300MHz, DMSO-d6 8. 39(1H, d, J=7.7Hz), 8. 29(1H, s), 8. 17(1H, d, J=1.5Hz), 8. 11(1H, d, J=8.8Hz), 7. 98(2H, m), 7. 73(2H, m), 7. 64(1H, t, J=8.4Hz), 7. 52(1H, d, J=8.0Hz), 7. 46(1H, dd, J=8.4, 1.8Hz), 7. 18(1H, dd, J=11.9, 2.0Hz), 7. 05(1H, dd, J=8.6, 2.4Hz), 5. 14(2H, s), 4. 13(2H, m), 2. 22(2H, m), 1. 88(4H, m) 1. 64(1H, m), 1. 34(3H, m), 1. 20(
純度	>90% (NMR)	6H, d, J=6. 6Hz)
MS	642 (M+1)	

表 245

実施例番号	401	1H NMR(δ) ppm
HCI CI	F HZ O	300MHz, DMSO-d6 8. 38 (1H, d, J=7.8Hz), 8. 28 (1H, s), 8. 20-8. 05 (2H, m), 8. 00-7. 9 0 (2H, m), 7. 65-7. 30 (5H, m), 7. 0 9 (1H, d, J=12. 3Hz), 6. 97 (1H, d, J=10. 2Hz), 5. 09 (2H, s), 4. 20-4 .00 (2H, m), 2. 30-2. 10 (2H, m), 2 .00-1. 80 (4H, m), 1. 70-1. 60 (1H, m), 1. 40-1. 10 (3H, m), 1. 19 (6H, d, J=6. 6Hz)
純度 >90% (N)	MR)	
MS 658 (M+1))	

実施例番号		402	1H NMR(δ) ppm
HCI O HO N	CI F	= -N	300MHz, DMSO-d6 8. 25 (1H, s), 8. 03 (1H, d, J=8. 7H z), 7. 91 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 83 (1H, s), 7. 70-7. 35 (6H, m), 7. 04 (1H, d, J=12. 0Hz), 6. 93 (1H, d, J=8. 4Hz), 5. 09 (2H, s), 4. 00 (1H, m), 3. 60-3. 40 (4H, m), 2. 30-2. 10 (2H, m), 1. 45-1. 15 (3H, m)
純度	90% (NMR)	
MS	670 (M+1)		

実施例番号	403	1H NMR(δ) ppm
HCI CI F	= O N	400MHz, DMSO-d6 8. 25 (1H, s), 8. 08 (1H, d, J=8. 4H z), 7. 92 (1H, d, J=9. 2Hz), 7. 79 (1H, s), 7. 66-7. 49 (4H, m), 7. 42 (1H, d, J=7. 6Hz), 7. 31-7. 28 (1H, m), 7. 14 (1H, d, J=11. 3Hz), 6. 99 (1H, d, J=8. 8Hz), 5. 13 (2H, s), 4 .02 (1H, m), 3. 54-3. 33 (4H, m), 2 .29-2. 08 (2H, m), 1. 93-1. 73 (8H, m), 1. 67-1. 52 (1H, m), 1. 48-1. 11 (3H, m)
純度 >90% (NM	IR)	7
MS 670 (M+1)		

HCI CI F	
HCI CI F	1H NMI
	400MHz 8.41(1 d, J=1. z), 8.1 1H, dt, .64(2H Hz, 1.9 z, 1.9H z, 2.3H), 2.3H , m), 2.
	46-1.
MS 658 (M+1)	

H NMR(δ) ppm

400MHz, DMSO-d6 8. 41 (1H, d, J=7.6Hz), 8. 32 (1H, d, J=1.5Hz), 8. 20 (1H, d, J=8.6H z), 8. 17 (1H, d, J=1.7Hz), 8. 00 (1H, dt, J=8.8Hz, 1.5Hz), 7. 71-7.64 (2H, m), 7. 54 (1H, dd, J=10.3 Hz, 1.9Hz), 7. 32 (1H, dd, J=8.2Hz, 1.9Hz), 7. 22 (1H, dd, J=12.1Hz, 2.3Hz), 7. 08 (1H, dd, J=8.6Hz), 2. 3Hz), 5. 17 (2H, s), 4. 15 (1H, m), 2. 31-2. 14 (2H, m), 1. 99-1.70 (4H, m), 1. 70-1.60 (1H, m); 1. 46-1.20 (3H, m), 1. 19 (6H, d, J=6.6Hz)

実施例番	号	405
HO	HCI S	N-O
純度	>90% (NMR)
MS	650 (M+1)	

1H NMR(δ) ppm

300MHz, DMSO-d6
8. 32 (1H, s), 8. 19 (1H, d, J=9. 0H z), 8. 03-7. 98 (2H, m), 7. 75 (1H, dd, J=2. 1Hz, 8. 4Hz), 7. 67 (1H, t, J=8. 6Hz), 7. 40-7. 36 (3H, m), 7. 32 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 19 (1H, dd, J=2. 1Hz, 12. 3Hz), 7. 07 (1H, dd, J=2. 1Hz, 8. 7Hz), 5. 11 (2H, s), 4. 12 (1H, m), 4. 12 (1H, m), 3. 90 (2H, t, J=6. 9Hz), 2. 54 (2H, t, J=8. 1Hz), 2. 50 (3H, s), 2. 40-2. 05 (4H, m), 2. 00-1. 75 (4H, m), 1. 70-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m)

実施例番	号	406
НО	HCI F O) } }
純度	>90% (NMR))
MS	652 (M+1)	

1H NMR(δ) ppm

300MHz, DMSO-d6 8. 34 (1H, d, J=7.7Hz), 8. 29 (1H, s), 8. 15 (1H, s), 8. 11 (1H, d, J=8.8Hz), 7. 97 (2H, d, J=9 .2Hz), 7. 63 (1H, t, J=8.8Hz), 7. 47-7. 31 (5H, m), 7. 18 (1H, dd, J=12.4, 2.2Hz), 7. 06 (1H, dd, J=12.4, 2.2Hz), 5. 13 (2H, s), 4. 13 (2H, m), 1. 96 (2H, m), 1. 87 (4H, m), 1. 62 (1H, m), 1. 34 (3H, m), 1. 20 (6H, d, J=6.2Hz)

表 247

実施例番号 407	IH NMR(δ) ppm
HCI CI CI O CI O N-S=0	400MHz, DMSO-d6 8. 32 (1H, d, J=1. 4Hz), 8. 20 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 01 (1H, dd, J=1. 6 Hz, 8. 8Hz), 7. 90 (1H, s), 7. 67 (1 H, t, J=8. 4Hz), 7. 61 (1H, s), 7. 5 5-7. 50 (4H, m), 7. 21 (1H, dd, J=2 .3Hz, 12. 0Hz), 7. 06 (1H, dd, J=2 .2Hz, 8. 7Hz), 5. 10 (2H, s), 4. 11 (1H, m), 3. 78 (2H, t, J=6. 7Hz), 3 .47 (2H, t, J=7. 4Hz), 2. 54-2. 48 (2H, m), 2. 40-2. 10 (2H, m), 2. 00 -1. 80 (4H, m), 1. 75-1. 55 (1H, m)
純度 >90% (NMR)	1. 50-1. 20 (3H, m)
MS 708 (M+1)	

実施例番号 408	3 1H NMR(δ) ppm
HCI CI HO PORTOR OF THE PORTOR	400MHz, DMSO-d6 8. 32 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 21 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 02 (1H, dd, J=1. 6 Hz, 8. 8Hz), 7. 76 (1H, s), 7. 68 (1 H, t, J=8. 5Hz), 7. 59 (1H, s), 7. 5 4-7. 51 (4H, m), 7. 21 (1H, dd, J=2 .4Hz, 12. 1Hz), 7. 07 (1H, dd, J=2 .4Hz, 8. 8Hz), 5. 08 (2H, s), 4. 11 (1H, m), 3. 77 (2H, t, J=6. 9Hz), 2 .47 (2H, t, J=8. 0Hz), 2. 40-2. 10 (4H, m), 2. 00-1. 80 (4H, m), 1. 70 -1. 60 (1H, m), 1. 45-1. 20 (3H, m)
純度 >90% (NMR)	-1. 00 (111, m), 1. 40 1. 20 (511, m)
MS 672 (M+1)	

実施例番号 4	109	1H NMR(δ) ppm
HCI CI HO P N P N P N P N P N P N P N P N P N P	ZI	300MHz, DMSO-d68. 28 (1H, d, J=1 .5Hz), 8. 20-8. 85 (4H, m), 7. 75 (1H, d, J=6. 9Hz), 7. 70-7. 45 (6H, m), 7. 13 (1H, dd, J=12. 0Hz, 2. 1Hz), 7. 00 (1H, dd, J=8. 7Hz), 2. 1Hz), 5. 22 (2H, s), 4. 05 (1H, m), 3. 40-3. 20 (1H, m), 2. 30-2. 10 (2H, m), 2. 00-1. 55 (5H, m), 1. 45-1. 10 (3H, m), 1. 00 (6H, d, J=6. 6Hz)
純度· >90% (NMR)		*
MS 676 (M+1)		

表 248

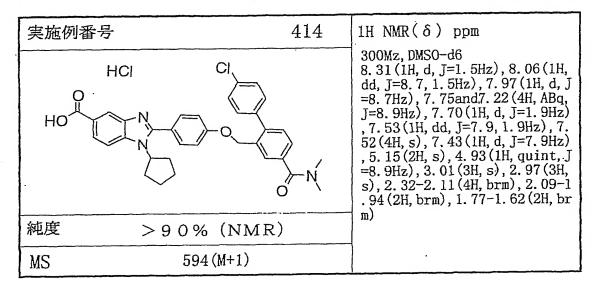
実施例番号		410	1H NMR(δ) ppm
НО	CI CI		300MHz, DMSO-d6 8. 31 (1H, s), 8. 00 (1H, d, J=8. 7H z), 7. 88 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 70 (1H, s), 7. 65 (1H, t, J=8. 4Hz), 7. 53 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 49 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 45-7. 41 (2H, m), 7. 16 (1H, d, J=12. 0Hz), 7. 04 (1H, d, J=8. 7Hz), 5. 14 (2H, s), 4. 68 (1H, quint, J=8. 4Hz), 3. 02, 2. 98 (6H, s), 2. 30-1. 85 (6H, m), 1. 80-1. 50 (2H, m)
純度	>90% (NMF	2)	
MS	612 (M+1)		

実施例番号	411	1H NMR(δ) ppm
HCI CI HO N F	→ N — OH	300MHz, DMSO-d6 8. 30 (1H, s), 7. 99 (1H, d, J=9. 0H z), 7. 87 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 67 (1H, s), 7. 64 (1H, t, J=8. 7Hz), 7. 53 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 45 (2H, d, J=7. 5Hz), 7. 45-7. 41 (2H, m), 7. 15 (1H, d, J=12. 3Hz), 7. 02 (1H, d, J=8. 4Hz), 5. 15 (2H, s), 4. 67 (1H, quint, J=8. 7Hz), 4. 02 (1H, m), 3. 76 (1H, m), 3. 55 (1H, m), 3. 22 (2H, m), 2. 40-1. 20 (12H, m)
純度 >90%	6 (NMR)	
MS 66	8 (M+1)	

実施例番号 4	12 1H NMR(δ) ppm
HCI CI HO N F O O	300MHz, DMSO-d6 8. 38 (1H, d, J=7. 5Hz), 8. 33 (1H, s), 8. 16 (1H, s), 8. 02 (1H, d, J=8 .7Hz), 7. 98 (1H, d, J=9. 0Hz), 7. 91 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 67 (1H, t, J=8. 4Hz), 7. 53 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 48 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 46 (1H, d, J=8. 1Hz), 7. 18 (1H, d, J=11. 7Hz), 7. 06 (1H, d, J=8. 7Hz), 5. 1 3 (2H, s), 4. 70 (1H, quint, J=8. 4 Hz), 4. 13 (1H, sept, J=6. 6Hz), 2 .30-1. 85 (6H, m), 1. 80-1. 50 (2H
純度 >90% (NMR)	, m), 1. 16 (6H, d, J=6. 3Hz)
MS 626 (M+1)	·

表 249

実施例番号	413	1H NMR(δ) ppm
HCI CI	- H	300Mz, DMSO-d6 8. 39(1H, d, J=7.5Hz), 8. 31(1H, d, J=1.5Hz), 8. 16(1H, d, J=1.9Hz), 8. 16(1H, d, J=1.9Hz), 8. 06(1H, dd, J=8.8, 1.5Hz), 7. 99-7. 95(2H, m), 7. 76and7. 24(4H, ABq, J=8.9Hz), 7. 53and7. 50(4H, A'B'q, J=9.1Hz), 7. 46(1H, d, J=8.3Hz), 5. 14(2H, s), 4. 94(1H, quint, J=9.0Hz), 4. 19-4.08(1H, m), 2. 32-2.11(4H, brm), 2. 10-1.95(2H, brm), 1. 78-1.62(2H, brm), 1. 26(3H, s), 1. 18(3H, d)
純度 >90% (NMF	₹)	s)
MS 608 (M+1)		



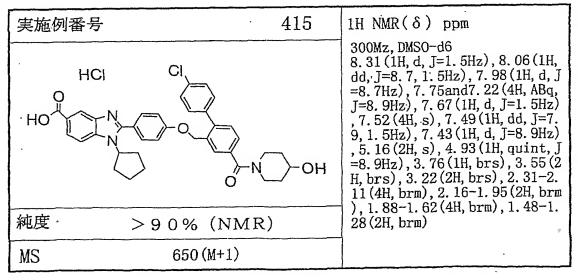


表 250

実施例番号	416	1H NMR(δ) ppm
HCI HO HCI N S	CI	300MHz, DMSO-d6 8. 38(1H, d, J=7.7Hz), 8. 30(1H, s), 8. 20-7. 90(4H, m), 7. 72(2H, d, J=8.7Hz), 7. 60-7. 40(5H, m), 7. 22(2H, d, J=8.7Hz), 5. 13(2H, s), 4. 47(1H, m), 4. 15(1H, m), 2. 90-2. 70(4H, m), 2. 60-2. 30(4H, m), 1. 19(6H, d, J=6.5Hz)
純度 >90%	(NMR)	
MS 640	(M+1)	·

実施例番号		417	1H NMR(δ) ppm
HCI HO	CI,		400MHz, DMSO-d6 8. 33 (1H, s), 8. 17 (1H, d, J=8. 6H z), 8. 10 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 82 (1H, d, J=1. 4Hz), 7. 74 (2H, d, J=8 . 7Hz), 7. 64 (1H, dd, J=8. 0Hz, 1. 7Hz), 7. 55-7. 50 (4H, m), 7. 43 (1 H, d, J=7. 8Hz), 7. 24 (1H, d, J=8. 7Hz), 5. 16 (2H, s), 4. 49 (1H, m), 3. 60-3. 40 (4H, m), 2. 90-2. 70 (4 H, m), 2. 60-2. 30 (4H, m), 2. 20-1 . 80 (4H, m)
純度	>90% ((NMR)	
MS	652 (M	(+1)	

実施例番号	3	418	1H NMR(δ) ppm
НО	HCI F		400MHz, DMSO-d6 8. 34 (1H, d, J=7.6Hz), 8. 25 (1H, s), 8. 11 (1H, d, J=1.3Hz), 7. 90- 8. 00 (3H, m), 7. 59 (1H, t, J=8.6H z), 7. 40-7. 55 (5H, m), 7. 12 (1H, d, J=11.9Hz), 7. 00 (1H, d, J=8.6 Hz), 5. 08 (2H, s), 4. 30-4. 10 (2H, m), 2. 80-2. 65 (4H, m), 2. 45-2. 30 (2H, m), 1. 15 (6H, d, J=4.8Hz)
純度	> 9 0 %	(NMR)	7
MS	. 658 ((M+1)	

表 251

実施例都	番号	419	1H NMR(δ) ppm
НО	HCI CI	N	400MHz, DMSO-d6 8.30(1H, s), 8.05-7.95(3H, m), 7.80-7.75(1H, m), 7.63(1H, t, J =8.6Hz), 7.55-7.35(5H, m), 7.1 5(1H, dd, J=12.1Hz, 2.1Hz), 7.0 3(1H, dd, J=8.7Hz, 2.3Hz), 5.10 (2H, s), 4.23(1H, m), 3.90(2H, t , J=7.0Hz), 2.95-2.70(4H, m), 2 .60-2.35(4H, m), 2.30-2.00(4H, m)
純度	>90% (NM	R)	
MS	656 (M+1)		

実施例番号	420	1H NMR(δ) ppm
HO	CI N N N	300Mz, DMSO-d6 8. 37 (1H, d, J=7.5Hz), 8. 28 (1H, d, J=1.5Hz), 8. 17 (1H, d, J=1.5Hz), 8. 17 (1H, d, J=1.5Hz), 8. 13 (1H, d, J=8.7Hz), 7. 97 (1H, dd, J=8.1, 1.5Hz), 7. 61 (1H, t, J=8.7Hz), 7. 51 and 7. 49 (4H, ABq, J=8.9Hz), 7. 46 (1H, d, J=8.1Hz), 7. 08 (1H, dd, J=12.4, 2.3Hz), 6. 97 (1H, dd, J=8.7, 2.3Hz), 5. 10 (2H, s), 4. 20-4. 08 (1H, m), 3. 62 -3. 56 (2H, brm), 3. 13-3. 10 (2H,
純度	>90% (NMR)	brm), 1.79-1.60 (3H, brm), 1.54 -1.34 (3H, brm), 1.21 (3H, s), 1.
MS	641 (M+1)	18 (3H, s)

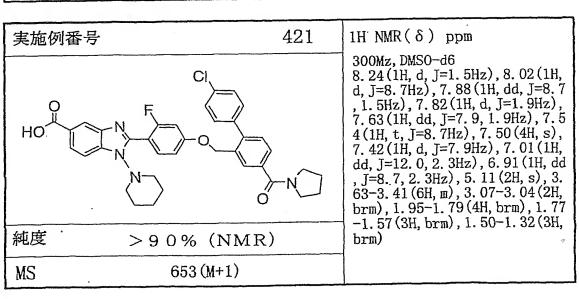


表 252

実施例番号	422	1H NMR(δ) ppm
2HCI HON F	CI	300MHz, DMSO-d6 10.99(2H, s), 8.44(1H, s), 8.30 (1H, s), 8.18(1H, d, J=8.7Hz), 8 .14(1H, d, J=8.7Hz), 7.98(1H, d , J=9.0Hz), 7.70-7.66(2H, m), 7 .57(2H, d, J=8.7Hz), 7.54(2H, d , J=8.7Hz), 7.21(1H, d, J=12.0H z), 7.09(1H, d, J=8.4Hz), 5.19(2H, s), 4.05(4H, s), 2.40-2.18(2H, m), 2.15-1.80(4H, m), 1.75- 1.55(1H, m), 1.50-1.20(3H, m)
純度 >90%	(NMR)	
MS 623	(M+1)	

実施例番	号	423	1H NMR(δ) ppm
НО	HCI F	CI	300MHz, DMSO-d6 8. 27 (1H, s), 8. 05 (1H, d, J=8. 7H z), 7. 93 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 90 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 59 (1H, t, J=8. 4Hz), 7. 50 (2H, d, J=9. 0Hz), 7. 45 (2H, d, J=8. 7Hz), 7. 41 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 12 (1H d, J=12. 0Hz), 7. 00 (1H, d, J=8. 7Hz), 5. 10 (2H, s), 4. 49 (2H, t, J =7. 8Hz), 4. 14 (2H, t, J=8. 0Hz), 4. 04 (1H, m), 2. 40-2. 10 (2H, m),
純度	> 9 0 %	(NMR)	2.00-1.50(5H, m), 1.45-1.20(3 H, m)
MS	640	(M+1)	

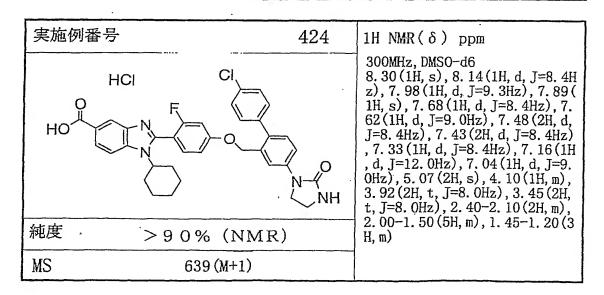


表 253

実施例番号		425	1H NMR(δ) ppm
2H	ICI F N N N N N N N N N N N N N N N N N N	N N	300MHz, DMSO-d6 9.05(1H, s), 8.30(1H, s), 8.16(1H, d, J=8.8Hz), 7.99(1H, d, J=8 .6Hz), 7.72(1H, s), 7.64(1H, t, J=8.6Hz), 7.52(1H, d, J=8.4Hz) , 7.47(2H, d, J=8.7Hz), 7.42(2H , d, J=8.6Hz), 7.25(1H, d, J=8.4 Hz), 7.15(1H, d, J=12.2Hz), 7.0 4(1H, d, J=8.6Hz), 6.60(1H, brs), 5.05(2H, s), 4.10(1H, m), 3.6 8(2H, t, J=6.1Hz), 3.45(2H, t, J =6.1Hz), 2.40-2.10(2H, m), 2.0
純度	>90% (NMR)		0-1. 55 (5H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m
MS	639 (M+1)		,

実施例番	号 .	426	1H NMR(δ) ppm
НО	HCI F	V O N	300MHz, DMSO-d6 8. 32 (1H, s), 8. 24 (1H, d, J=8. 7H z), 8. 03 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 78- 7. 73 (4H, m), 7. 38-7. 32 (4H, m), 5. 52 (2H, s), 4. 88 (2H, s), 4. 40 (2H, s), 4. 37 (1H, m), 2. 92, 2. 84 (6H, s), 2. 40-2. 18 (2H, m), 2. 15- 1. 95 (2H, m), 1. 90-1. 80 (2H, m), 1. 75-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3 H, m)
純度	>90% (N	MR)	·
MS	643 (M+1))	

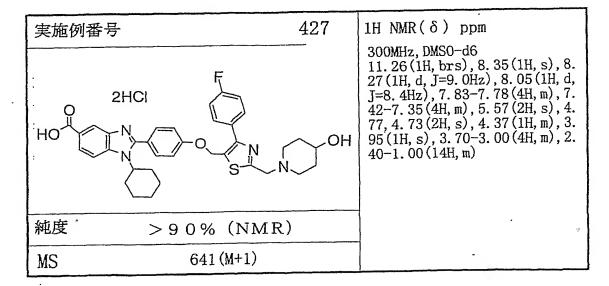


表 254

実施例番号		428	1H NMR(δ) ppm
HCI HO N	John S. O.	O NH ₂	300MHz, DMSO-d6 8.31(1H, s), 8.26(1H, d, J=9.0H z), 8.04(1H, d, J=8.7Hz), 7.79- 7.73(4H, m), 7.38-7.31(6H, m), 5.53(2H, s), 4.90(2H, s), 4.37(1H, m), 4.05(2H, s), 2.40-2.18(2H, m), 2.15-1.95(2H, m), 1.90- 1.80(2H, m), 1.75-1.55(1H, m), 1.50-1.20(3H, m)
純度	>90% (NMR)		
MS	615 (M+1)		·

実施例番号	. 4	129	1H NMR(δ) ppm
HO HC	F N S O	Η,	300MHz, DMSO-d6 8. 88 (1H, q, J=4. 5Hz), 8. 33 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 18 (1H, d, J=8. 7Hz), 8. 01 (1H, dd, J=1. 5Hz, 8. 7Hz), 7. 89-7. 83 (2H, m), 7. 50-7. 34 (3H, m), 7. 20 (1H, dd, J=2. 1Hz, 8. 4Hz), 5. 61 (2H, s), 4. 13 (1H, m), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 40-2. 10 (2H, m), 2. 00-1. 75 (4H, m), 1. 70-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m)
純度	>90% (NMR)		
MS	603 (M+1)		

実施例番号 430	1H NMR(δ) ppm
HCI F N H NOH	400MHz, DMSO-d6 8.79(1H, t, J=5.9Hz), 8.31(1H, s), 8.15(1H, d, J=8.7Hz), 7.99(1H, d, J=8.8Hz), 7.87(1H, d, J=8.1Hz), 7.85(1H, d, J=8.7Hz), 7.70(1H, t, J=8.4Hz), 7.42-7.33(3H, m), 7.18(1H, d, J=8.8Hz), 5.60(2H, s), 4.11(1H, m), 3.62-3.54(4H, m), 2.40-2.10(2H, m), 2.00-1.75(4H, m), 1.70-1.55(1H, m), 1.50-1.20(3H, m)
純度 > 90% (NMR)	4
MS 633 (M+1)	

表 255

実施例番号	431	1H NMR(δ) ppm
HCI O F HO N	F S N O	300MHz, DMSO-d6 8. 31 (1H, s), 8. 16 (1H, d, J=8. 8H z), 7. 99 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 74- 7. 60 (4H, m), 7. 37 (2H, t, J=8. 8H z), 7. 28 (1H, dd, J=2. 2Hz, 12. 2H z), 7. 14 (1H, dd, J=2. 2Hz, 8. 6Hz), 5. 17 (2H, s), 4. 10 (1H, m), 3. 1 5 (6H, brs), 2. 40-2. 10 (2H, m), 2 .00-1. 75 (4H, m), 1. 70-1. 55 (1H , m), 1. 50-1. 15 (3H, m)
純度 > 9	0% (NMR)	
MS	616 (M+1)	

実施例番号	432	1H NMR(δ) ppm
HCI HO N	S HX	300MHz, DMSO-d6 8. 45 (1H, d, J=7. 7Hz), 8. 32 (1H, s), 8. 19 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 02-7. 99 (2H, m), 7. 70 (1H, t, J=8. 6Hz), 7. 60 (2H, dd, J=5. 4Hz, 8. 7Hz), 7. 37 (2H, t, J=8. 8Hz), 7. 27 (1H, dd, J=2. 3Hz, 12. 2Hz), 7. 14 (1H, dd, J=2. 2Hz, 8. 7Hz), 5. 16 (2Hz, s), 4. 20-4. 00 (2H, m), 2. 40-2. 10 (2H, m), 2. 00-1. 75 (4H, m), 1. 70-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m), 1. 18 (6H, d, J=6. 6Hz)
純度 >90%	6 (NMR)	m, 1. 10 (oii, 6, 3 of 11-17)
MS 630	O(M+1)	

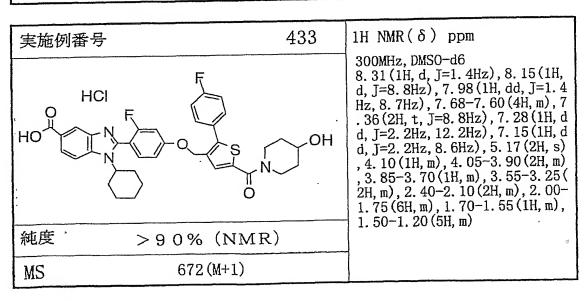


表 256

実施例番号		434	1H NMR(δ) ppm
Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z Z	F F	CI	300Mz, DMSO-d6 8. 45(1H, d, J=1.5Hz), 8. 26(1H, d, J=8.8Hz), 8. 10(1H, dd, J=8.8, 1.5Hz), 7. 72(1H, d, J=1.5Hz), 7. 64(1H, t, J=8.6Hz), 7. 56-7. 48(5H, m), 7. 44(1H, d, J=J=7.7Hz), 7. 18(1H, dd, J=12.3, 2.4Hz), 7. 04(1H, dd, J=8.6, 2.4Hz), 5. 15(2H, s), 4. 08(1H, brt, J=11.7Hz), 3. 02(3H, s), 2. 99(3H, s), 2. 34-2. 17(2H, brm), 1. 97-1. 81(4H, brm), 1. 70-1. 60
純度	> 9 0 %	(NMR)	(1H, brm), 1. 49-1. 21 (3H, brm)
MS .	650 (M+1)	

実施例番号		435	1H NMR(δ) ppm
Z Z I	HCI OH	CI	300Mz, DMSO-d6 8. 42(1H, d, J=1.5Hz), 8. 24(1H, d, J=8.8Hz), 8. 08(1H, dd, J=8.8Hz), 8. 00(2H, d, J=8.8Hz), 7. 79(1H, d, J=7.8Hz), 7. 62(1H, t, J=8.4Hz), 7. 61-7.55(3H, m), 7. 44(1H, d, J=8.1Hz), 7. 16(1H, dd, J=12.1, 2.6Hz), 7. 02(1H, dd, J=8.4, 2.6Hz), 5. 12(2H, s), 4. 07(1H, brt, J=12.5Hz), 2. 33(2H, brm), 1. 96-1. 79(4H, brm), 1. 71-1. 61(1H, brm), 1. 49-1. 21(3H
純度	>90% (NM	(R)	, brm)
MS	623 (M+1)		

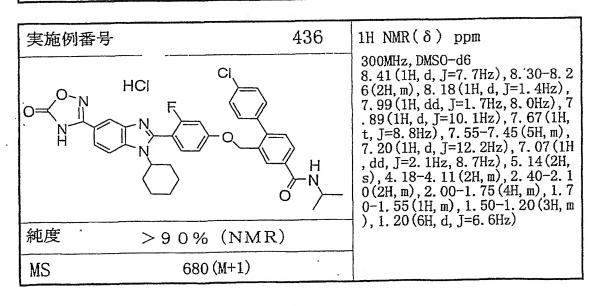


表 257

実施例番	号 2	137	1H NMR(δ) ppm
N	CI N F O O	•он	
純度	>90% (NMR)		·
MS	580 (M+1)		

実施例都	5号	438	1H NMR(δ)	ppm
N _M	CI, CI, N, F, O, N, O, N	- - - - - - - - - - - - - - - - - - -		
純度	>90% (NMR)		
MS	607 (M+1)			

実施例番号	439	1H NMR(δ) ppm
HO N	O N-	300MHz, CDC13 8. 60 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 05 (1H, dd, J=1. 6Hz, 8. 7Hz), 7. 70 (1H, d , J=8. 7Hz), 7. 62 (2H, d, J=8. 2Hz), 7. 49 (2H, d, J=8. 2Hz), 7. 31 (2 H, d, J=8. 8Hz), 7. 27-7. 23 (2H, m), 7. 06 (2H, t, J=8. 6Hz), 6. 80 (2 H, d, J=8. 8Hz), 5. 05 (2H, s), 4. 3 8 (1H, m), 3. 06 (6H, s), 2. 45-2. 2 0 (2H, m), 2. 10-1. 70 (5H, m), 1. 5 0-1. 20 (3H, m)
純度 >90% (N	MR)	9
MS 591 (M+1)	

表 258

実施例番号		440	1H NMR(δ) ppm
HOLLY	F OH F		300MHz, DMSO-d6 8. 20(1H, s), 7. 86(2H, m), 7. 39(1H, d, J=7.9Hz), 7. 34(1H, d, J=7.9Hz), 7. 07(2H, dt, J=2. 3Hz, 8.6Hz), 6. 98-6. 88(5H, m), 6. 83(1H, d, J=8. 3Hz), 5. 91(1H, s), 3. 96(1H, m), 2. 30-1. 95(2H, m), 1. 90-1. 50(4H, m), 1. 40-1. 10(3H, m)
純度 >	90% (NMR)		
MS	557 (M+1)		

実施例番	·号	441	1H NMR(δ) ppm
о Но ^Д	F F OH		300MHz, DMSO-d6 8. 24 (1H, d, J=1. 4Hz), 8. 01 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 91 (1H, dd, J=1. 4 Hz, 8. 7Hz), 7. 47 (1H, t, J=8. 4Hz), 7. 43-7. 35 (2H, m), 7. 15-7. 01 (5H, m), 6. 92 (2H, d, J=10. 4Hz), 6. 11 (1H, s), 3. 90 (1H, m), 2. 30-1. 95 (2H, m), 1. 90-1. 50 (4H, m), 1. 40-1. 10 (3H, m)
純度	>90% (NMR)		
MS	557 (M+1)	•	

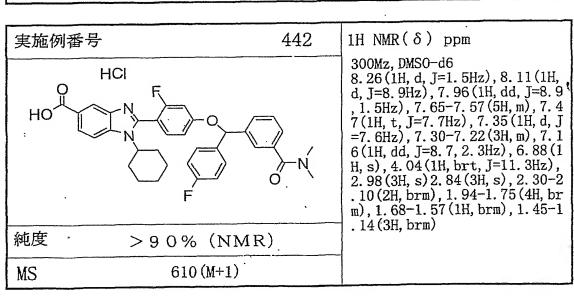


表 259

実施例番号	3	443	1H NMR(δ) ppm
НО	F F	○ -N ○ -ОН	300Mz, DMSO-d6 8.23(1H, s), 7.98and7.89(2H, A Bq, J=8.8Hz), 7.62-7.06(11H, m), 6.86(1H, s), 4.12-3.77(2H, b rm), 3.72(1H, brs), 3.69(1H, br s), 3.18(1H, brs), 3.05(1H, brs), 2.31-2.08(2H, brm), 1.90-1. 54(7H, brm), 1.48-1.13(5H, brm)
純度	>90% (NMR)	
MS	666 (M	(+1)	

実施例番号	444	1H NMR(δ) ppm
HO HO O	O N N S N	300MHz, DMSO-d6 8. 36 (1H, s), 8. 00 (1H, d, J=8. 7H z), 7. 90 (1H, d, J=9. 3Hz), 7. 80-7. 70 (2H, m), 7. 63 (2H, d, J=8. 4H z), 7. 32 (2H, t, J=8. 7Hz), 7. 22 (2H, d, J=8. 4Hz), 5. 62 (1H, d, J=7.5Hz), 5. 57 (1H, brd, J=4. 8Hz), 5. 41 (2H, s), 5. 31 (1H, m), 4. 29 (1H, m), 3. 84 (1H, d, J=9. 0Hz), 3. 50-3. 20 (3H, m), 2. 71 (3H, s), 2. 40-2. 20 (2H, m), 1. 75-1. 60 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m)
純度	>90% (NMR)	m/, 1. 50-1. 20 (311, m/
MS	718 (M+1)	

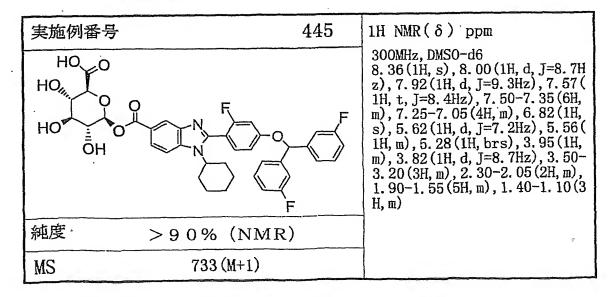


表 260

実施例番	号 ·	446	1H NMR(δ) ppm
но	HCI F		300MHz, DMSO-d6 8. 29 (1H, s), 8. 13 (1H, d, J=9. 0H z), 7. 97 (1H, d, J=9. 0Hz), 7. 63 (1H, t, J=8. 6Hz), 7. 51-7. 32 (7H, m), 7. 15 (1H, d, J=12. 0Hz), 7. 03 (1H, d, J=9. 0Hz), 5. 10 (2H, s), 4 .09 (1H, m), 3. 82 (2H, t, J=6. 3Hz), 3. 56 (2H, t, J=7. 4Hz), 2. 45 (2 H, m), 2. 40-2. 10 (2H, m), 2. 00-1 .55 (5H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m)
純度	>90% (NMR)		
MS	674 (M+1)		

実施例番号	447	1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6
0 H ₂ N S	CI N N N N O N	8. 36 (1H, d, J=7. 7Hz), 8. 14 (2H, d, J=12. 1Hz), 8. 08 (1H, d, J=8. 5Hz), 7. 97 (1H, dd, J=1. 7Hz, 8. 3Hz), 7. 7 4 (1H, dd, J=1. 8Hz, 8. 4Hz), 7. 58-7 . 45 (6H, m), 7. 31 (2H, s), 7. 12 (1H, dd, J=2. 2Hz, 12. 1Hz), 7. 00 (1H, dd, J=2. 4Hz, 8. 6Hz), 5. 11 (2H, s), 4. 16 (1H, m), 4. 02 (1H, m), 2. 20 (2H, m), 1. 86 (4H, m), 1. 62 (1H, m), 1. 21 (
純度	>90% (NMR)	9H, m)
MS .	675 (M+1)	•

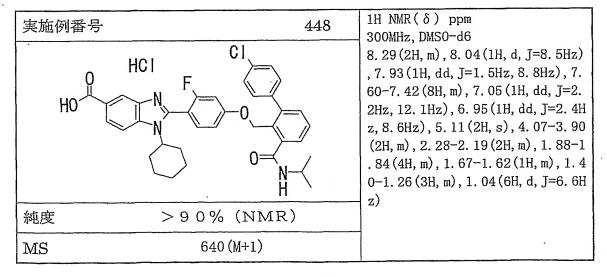


表 261

実施例番号	449
НО	
純度	>90% (NMR)
MS	692 (M+1)

1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6

8. 31 (1H, s), 8. 17 (1H, d, J=8. 7Hz), 8. 00 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 78 (1H, d, J=8. 1Hz), 7. 66 (1H, t, J=8. 7Hz), 7. 5 5-7. 45 (4H, m), 7. 40 (1H, d, J=11. 7Hz), 7. 19 (1H, d, J=12. 3Hz), 7. 05 (1H, d, J=8. 7Hz), 5. 07 (2H, s), 4. 10 (1H, m), 3. 85 (2H, t, J=6. 6Hz), 3. 47 (2H, t, J=7. 5z) 2. 60-2. 50 (2H, m), 2. 40 -2. 10 (2H, m), 2. 00-1. 80 (4H, m), 1. 75-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m)

実施例番号			450
H0 0 0	HC I		H N
純度	> 9 ()% (NMR)	
MS		670 (M+1)	

1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6

8. 37 (1H, d, J=7. 8Hz), 8. 15 (1H, s), 7. 97 (1H, d, J=9. 8Hz), 7. 64-7. 45 (8 H, m), 7. 12 (1H, d, J=12. 1Hz), 7. 00 (1H, d, J=8. 6Hz), 5. 11 (2H, s), 4. 21 (3H, s), 4. 18-4. 05 (1H, m), 4. 04-3. 8 9 (1H, m), 2. 29-2. 08 (2H, m), 1. 90-1. 74 (4H, m), 1. 68-1. 58 (1H, m), 1. 40 -1. 17 (3H, m), 1. 20 (6H, d, J=6. 6Hz)

実施例番号		451
H0 H0	HCI CI N N N N N N N N N N N N N N N N N	0
純度	>90% (NMR)	
MS	654 (M+1)	

1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6

8. 29 (1H, s), 8. 12 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 97 (1H, d, J=10. 2Hz), 7. 65-7. 59 (2H, m), 7. 51 (4H, s), 7. 46 (2H, s), 7. 15 (1H, d, J=12. 2Hz), 7. 01 (1H, d, J=8. 6Hz), 5. 15 (2H, s), 4. 13-3. 98 (1H, m), 3. 21 (3H, s), 2. 56-2. 42 (1H, m), 2. 30-2. 15 (2H, m), 1. 95-1. 77 (4H, m), 1. 69-1. 59 (1H, m), 1. 45-1. 17 (3H, m), 0. 96 (6H, d, J=6. 5Hz)

表 262

実施例番号		52
НО	HCI F N N N N H	0
純度	>90% (NMR)	
MS	640 (M+1)	

1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6

10.1 (1H, s), 8.28 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=8.7Hz), 7.96 (1H, d, J=11.4Hz), 7.95 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=8.7Hz), 7.62 (1H, t, J=9.0Hz), 7.48 and 7.43 (4H, ABq, J=8.4Hz), 7.31 (1H, d, J=8.4Hz), 7.13 (1H, d, J=12:0Hz), 7.02 (1H, d, J=9.0Hz), 5.07 (2H, s), 4.14-4.00 (1H, m), 2.69-2.59 (1H, m), 2.30-2.12 (2H, m), 1.95-1.77 (4H, m), 1.71-1.57 (1H, m), 1.45-1.20 (3H, m), 1.12 (6H, d, J=6.9Hz)

1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6

11.1 (1H, brs), 8.31 (1H, d, J=9.4Hz), 8.29 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=10.2Hz), 7.70-7.62 (3H, m), 7.31-7.23 (3H, m), 4.40-4.23 (1H, m), 4.24 (2H, s), 2.61 (3H, s), 2.34-2.14 (2H, m), 1.99-1.72 (4H, m), 1.66-1.54 (1H, m), 1.46-1.30 (1H, m), 1.27-1.08 (2H, m)

実施例番号	454
НО	HCI F O F O
純度	>90% (NMR)
MS	656 (M+1)

1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6

8. 27 (1H, d, J=1. 4Hz), 8. 05 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 92 (1H, d; J=8. 7Hz), 7. 7 9 (1H, d, J=7. 8Hz), 7. 59 (1H, t, J=8. 6Hz), 7. 55-7. 45 (4H, m), 7. 37 (1H, d; J=11. 4Hz), 7. 14 (1H, d, J=12. 1Hz), 7. 01 (1H, d, J=8. 6Hz), 5. 04 (2H, s), 4. 10 (1H, m), 3. 84 (2H, t, J=6. 9Hz), 2. 55-2. 45 (2H, m), 2. 40-2. 10 (4H, m), 2. 00-1. 80 (4H, m), 1. 75-1. 55 (1H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m)

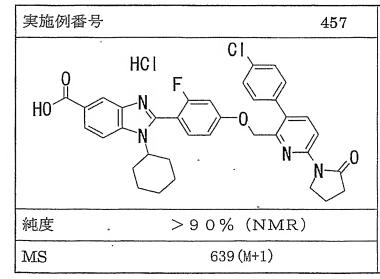
表 263

実施例番号		455	1H NMR(δ) ppm 300MHz,DMSO-d6
HO	HCI F O	O NH	10. 05 (1H, brs), 8. 32 z), 8. 19 (1H, d, J=8. 8 d, J=8. 7Hz), 7. 67 (1H 7. 50-7. 41 (5H, m), 7.), 7. 17 (1H, dd, J=2. 2 L, 05 (1H, dd, J=2. 2Hz, 2H, s), 4. 12 (1H, m), 3 40-2. 10 (2H, m), 2. 00 1. 75-1. 55 (1H, m), 1. m)
純度	> 9 0 % (NI	MR)	m)
MS	648 (M+1)		

(1H, d, J=1.3H Hz), 8.01 (1H, l, t, J=8.6Hz), 38-7.33(2H, m Hz, 12. 2Hz), 7 8.7Hz), 5.10(.07(3H, s), 2. ⊢1.80(4H, m), 50-1.20 (3H,

実施例番号	클	456 ·
HO .	HCI CI	
純度	> 90% (1	JMR) ·
MS	662 (M+	1)

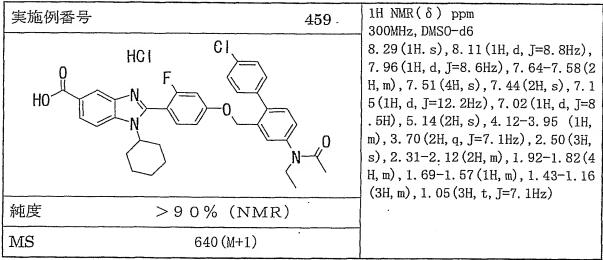
1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, d, J=1.4Hz), 8.17 (1H, d, J =8.8Hz), 8.00 (1H, dd, J=1.5Hz, 8.7 Hz), 7. 73 (1H, d, J=2. 3Hz), 7. 66 (1H , t, J=8. 6Hz), 7. 56 (1H, dd, J=2. 3Hz , 8. 3Hz), 7. 50-7. 47 (4H, m), 7. 42 (1 H, d, J=8. 3Hz), 7. 19 (1H, d, J=12. 2H z), 7. 06 (1H, dd, J=2. 2Hz, 8. 6Hz), 5 .11(2H, s), 4.10(1H, m), 3.31(3H, s), 3. 03 (3H, s), 2. 40-2. 10 (2H, m), 2 .00-1.80(4H, m), 1.75-1.55(1H, m) , 1.50-1.20 (3H, m)



1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8. 41 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 28 (1H, s), 8. 10 (1H, d, J=9. 2Hz), 7. 96 (1H, d, J =8.8Hz), 7.87(1H, d, J=8.8Hz), 7.6 1 (1H, dd, J=8.5Hz, 8.5Hz), 7.56-7. 49 (4H, m), 7. 19 (1H, dd, J=2. 4Hz, 12 . 2Hz), 7. 05 (1H, dd, J=2. 4Hz, 8. 7Hz), 5. 18 (2H, s), 4. 06-3. 97 (4H, m), 2 .62(2H, t, J=8.1Hz), 2.28-2.15(2H , m), 2.11-2.01(4H, m), 1.91-1.87(4H, m), 1.64(1H, m), 1.43-1.23(3H, m)

表 264

実施例番号	458	1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6
HO 0	HCI CI N N H	10. 19(1H, s), 8. 29(1H, s), 8. 14(1 H, d, J=8. 8Hz), 7. 98(1H, dd, J=1. 7H z, 8. 7Hz), 7. 90(1H, d, J=2. 2Hz), 7. 69(1H, dd, J=2. 2Hz, 8. 4Hz), 7. 64(1 H, dd, J=8. 5Hz, 8. 5Hz), 7. 50-7. 42(4H, m), 7. 32(1H, d, J=8. 4 Hz), 7. 14(1H, dd, J=2. 5Hz, 12. 1Hz), 7. 02(1H, dd, J=2. 4Hz, 8. 6Hz), 5. 08(2H, s), 4. 17-4. 02(1H, m), 2. 30-2. 18(2H, m), 2. 08(3H, s), 1. 87-1. 79(4H, m), 1
純度	>90% (NMR)	. 68-1. 59 (1H, m), 1. 35-1. 23 (3H, m)
MS	612 (M+1)	



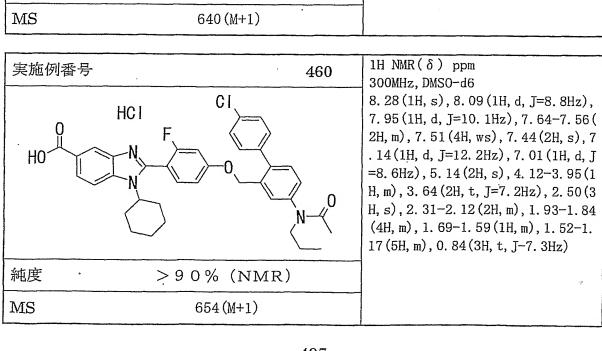
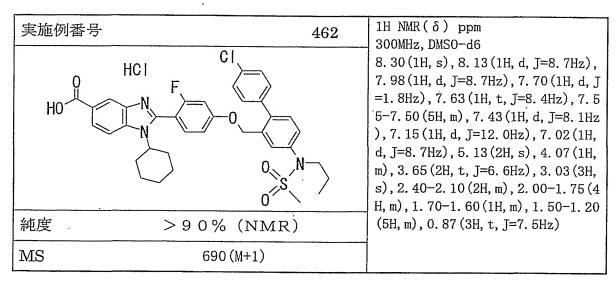


表 265

実施例番号 4	31
HCI CI HO N F O S N O S	8. 30 (1H, s), 8. 13 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 99 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 69 (1H, s), 7. 62 (1H, t, J=8. 4Hz), 7. 96-7. 50 (4 H, m), 7. 45 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 17 (1 H, dd, J=2. 3Hz, 12. 0Hz), 7. 05 (1H, d d, J=2. 2Hz, 8. 7Hz), 5. 14 (2H, s), 4. 07 (1H, m), 3. 73 (2H, q, J=7. 2Hz), 3. 05 (3H, s), 2. 40-2. 10 (2H, m), 2. 00- 1. 80 (4H, m), 1. 75-1. 55 (1H, m), 1. 5 0-1. 20 (3H, m), 1. 06 (3H, t, J=7. 2Hz)
純度 >90% (NMR))
MS 676 (M+1)	



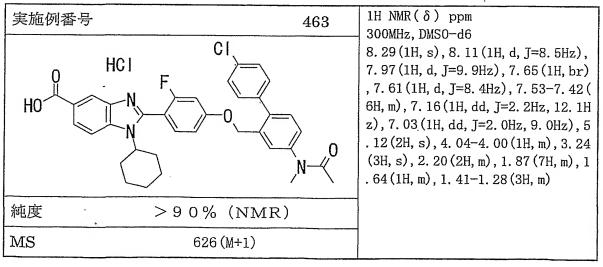


表 266

実施例番号	464	1H NMR(δ) ppm 300MHz,DMSO-d6
H0 H0	HCI F O N-S=0	8. 28 (1H, s), 8. 09 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 95 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 73 (1H, d, J=2. 2Hz), 7. 63-7. 39 (7H, m), 7. 15 (1H, dd, J=2. 2Hz, 12. 1Hz), 7. 01 (1H, dd, J=2. 0Hz, 8. 6Hz), 5. 10 (2H, s), 4. 05-3. 99 (1H, m), 3. 34 (3H, s), 3. 23 (2H, q, J=7. 2Hz), 2. 20 (2H, m), 1. 87 (4H, m), 1. 62 (1H, m), 1. 33 (3H, m), 1. 24 (3H, t, J=7. 3Hz)
純度	>90% (NMR)	
MS	676 (M+1)	

実施例番号	465	1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6
НО	HCI F 0 N S 0	8. 29 (1H, d, J=1. 6 J=8. 8Hz), 7. 98 (1 . 4Hz), 7. 69 (1H, 6 (1H, dd, J=8. 6Hz, 47 (5H, m), 7. 43 (1 . 16 (1H, dd, J=2. 4 2 (1H, dd, J=2. 4Hz, 4, s), 4. 09-4. 02
純度	>90% (NMR)	q, J=6.8Hz), 3.19
MS	690 (M+1)	, 2. 25-2. 21 (2H, r, m), 1. 63 (1H, m),), 1. 27 (3H, t, J=7 t, J=6. 9Hz)

300MHz, DMSO-d6
8. 29 (1H, d, J=1. 5Hz), 8. 11 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 98 (1H, dd, J=1. 4Hz, 8. 4Hz), 7. 69 (1H, d, J=2. 2Hz), 7. 62 (1H, dd, J=8. 6Hz, 8. 6Hz), 7. 56-7. 47 (5H, m), 7. 43 (1H, d, J=8. 1Hz), 7. 16 (1H, dd, J=2. 2Hz, 12. 1Hz), 7. 0 2 (1H, dd, J=2. 4Hz, 8. 7Hz), 5. 13 (2 H, s), 4. 09-4. 02 (1H, m), 3. 77 (2H, q, J=6. 8Hz), 3. 19 (2H, q, J=7. 4Hz), 2. 25-2. 21 (2H, m), 1. 90-1. 87 (4H, m), 1. 63 (1H, m), 1. 39-1. 33 (3H, m), 1. 27 (3H, t, J=7. 4Hz), 1. 06 (3H, t, J=6. 9Hz)

実施例番号			466
H0 H0	HCI F N		
純度	. > 9	0% (NI	MR)
MS		640 (M+1)	

300MHz, DMSO-d6
8. 28 (1H, s), 8. 10 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 96 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 64 (1H, s), 7. 61 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 50 (4H, s), 7. 44 (2H, s), 7. 14 (1H, d, J=12. 0Hz), 7. 02 (1H, d, J=8. 4Hz), 5. 12 (2H, s), 4. 12-3. 95 (1H, m), 3. 23 (3H, s), 2. 32-2. 06 (4H, m), 1. 94-1. 77 (4H, m), 1. 70-1. 59 (1H, m), 1. 42-1. 18 (3H, m), 0. 96 (3H, t, J=7. 2Hz)

1H NMR(δ) ppm

表 267

実施例番号	467
HO HC	CI F O N-O
純度	>90% (NMR)
MS	654 (M+1)

1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8. 28 (1H, s), 8. 08 (1H, d, J=8. 7H z), 7. 95 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 60 (1H, t, J=8. 4Hz), 7. 59 (1H, s), 7. 51 (4H, s), 7. 45and7. 42 (2H, ABq , J=8. 1Hz), 7. 14 (1H, d, J=12. 0H z), 7. 00 (1H, d, J=8. 4Hz), 5. 14 (2H, s), 4. 12-3. 95 (1H, m), 3. 70 (2H, q, J=6. 9Hz), 2. 30-1. 98 (4H, m), 1. 94-1. 79 (4H, m), 1. 69-1. 5 9 (1H, m), 1. 45-1. 17 (3H, m), 1. 0 5 (3H, t, J=6. 9Hz), 0. 94 (3H, t, J =7. 5Hz)

実施例番号	468
НО	CI F O
純度	>90% (NMR)
MS	585 (M+1)

1H NMR(δ) ppm 400MHz, DMSO-d6 8. 25(1H, s), 7. 96(1H, d, J=8. 8H z), 7. 90(1H, d, J=8. 8Hz), 7. 55(1H, t, J=8. 4Hz), 7. 46(2H, d, J=8 . 7Hz), 7. 41(2H, d, J=8. 7Hz), 7. 10-7. 00(2H, m), 6. 98(1H, dd, J=2. 2Hz, 8. 7Hz), 5. 05(2H, s), 3. 9 8(1H, m), 3. 84(3H, s), 2. 30-2. 1 0(2H, m), 1. 90-1. 75(4H, m), 1. 7 0-1. 60(1H, m), 1. 50-1. 20(3H, m)

実施例番号	469
O HCI	F O N O
純度	>90% (NMR)
MS	654 (M+1)

1H NMR(δ) ppm 400MHz, DMSO-d6 8. 26 (1H, s), 8. 02 (1H, d, J=8. 8H z), 7. 93 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 60-7. 50 (6H, m), 7. 45 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 08 (1H, dd, J=2. 3Hz, 12. 0Hz), 6. 97 (1H, dd, J=2. 2Hz, 8. 7Hz), 5. 18 (2H, s), 4. 85 (1H, sept, J=6. 6Hz), 3. 98 (1H, m), 2. 40-2. 10 (2H, m), 2. 00-1. 80 (4H, m), 1. 75-1. 55 (4H, m), 1. 50-1. 20 (3H, m), 1. 02 (6H, d, J=6. 6Hz)

実施例番号	470)
H0 0 H0 0 H0 0 OH	F CI	J 0
純度	>90% (NMR)	
MS	814 (M+1)	

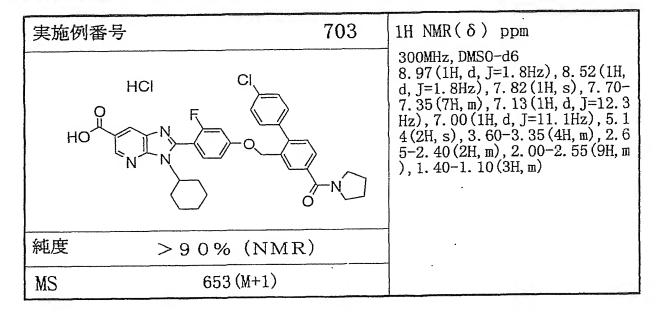
1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8. 39 (1H, d, J=1. 4Hz), 8. 04 (1H, d, J=8.8Hz), 7.98(1H, d, J=2.2Hz), 7 .95(1H, d, J=8.8Hz), 7.78(1H, dd, J=2. 3Hz, 8. 5Hz), 7. 57 (1H, t, J=8. 6Hz), 7. 50 (2H, d, J=8.8Hz), 7. 45 (2H, d, J=8.8Hz), 7.39 (1H, d, J=8.4 Hz), 7. 10 (1H, d, J=12. 1Hz), 6. 98 (1H, d, J=8. 6Hz), 5. 65-5. 60 (2H, m) , 5. 35 (1H, d, J=4. 2Hz), 5. 08 (2H, s), 4.00(1H, m), 3.93-3.84(3H, m), 3. 50-3. 30 (4H, m) 2. 54 (2H, t, J=7. 8Hz), 2.40-2.00(4H, m), 1.95-1.7 5 (4H, m), 1. 70-1. 55 (1H, m), 1. 45-1.15(3H, m)

実施例番号 471 HO N 純度 > 90% (NMR) MS 311 (M+1)

1H NMR(δ) ppm 300MHz, DMS0-d6 12.78(1H, brs), 8.30(1H, dd, J=0. 9Hz, 1.5Hz), 8.22(1H, d, J=1.5Hz), 7.95(1H, d, J=1.8Hz), 7.94(1H, d, J=8.4Hz), 7.85(1H, dd, J=1.2Hz, 8.4Hz), 6.96(1H, dd, J=0.9Hz, 1.8 Hz), 4.46(1H, m), 2.40-2.10(2H, m), 2.00-1.20(8H, m)

表 269

実施例番号 702	1H NMR(δ) ppm
HCI CI HO H N N N N N N N N N N N N N N N N N	300MHz, DMSO-d6 8.97(1H, d, J=1.8Hz), 8.52(1H, d, J=2.4Hz), 8.36(1H, d, J=7.8Hz), 8.16(1H, s), 7.96(!H, d, J=8.1Hz), 7.55-7.40(5H, m), 7.14(1H, d, J=12.6Hz), 7.01(1H, dd, J=8.4Hz, 1.8Hz), 5.11(2H, s), 4.20-3.95(2H, m), 2.65-2.45(2H, m), 1.95-1.80(5H, m), 1.20-1.10(3H, m)
純度 >90% (NMR)	
MS 641 (M+1)	



産業上の利用可能性

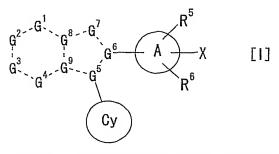
上記結果から明らかな様に、本発明の化合物はHCVポリメラーゼに対し高い 阻害活性を示す。

よって、これら化合物は、HCVポリメラーゼ阻害活性により抗HCV作用を示すC型肝炎の予防若しくは治療に有効な薬剤となり得る。また、インターフェロン等の他の抗HCV剤及び/又は他の抗炎症剤等との併用によりC型肝炎の予防若しくは治療により有効な薬剤となり得る。また、HCVポリメラーゼに特異的な高い阻害活性を有することは、人体に対し安全な副作用の少ない薬剤となり得ることを示す。

本出願は、日本で出願された特願2001-193786及び特願2001-351537を基礎としており、それらの内容は本明細書に包含されるものである。

請求の範囲

1. 下記一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を 有効成分として含んで成る C型肝炎治療剤。



「式中、破線は単結合又は二重結合であり、

 G^1 は、 $C(-R^1)$ 又は窒素原子であり、

 G^2 は、 $C(-R^2)$ 又は窒素原子であり、

 G^3 は、 $C(-R^3)$ 又は窒素原子であり、

 G^4 は、 $C(-R^4)$ 又は窒素原子であり、

 G^5 、 G^6 、 G^8 及び G^9 、は、それぞれ独立して、炭素原子又は窒素原子であり、 G^7 は、 $C(-R^7)$ 、酸素原子、硫黄原子、又は R^8 で置換されてもよい窒素原子で

あり、

ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、それぞれ独立して、

- (1)水素原子、
- (2) C1-6 アルカノイル基、
- (3)カルボキシル基、
- (4)シアノ基、
- (5) ニトロ基、
- (6)下記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC1-6 アルキル基、

グループA; ハロゲン原子、水酸基、カルボキシル基、アミノ基、C1-6 アルコキシ基、C1-6 アルコキシC1-6 アルコキシ基、C1-6 アルコキシカルボニル基及びC1-6 アルキルアミノ基。

 $(7) - COOR^{a1}$

ここでR^{®1}は、置換されてもよいC1-6アルキル基(前記定義の通り。)、下記

グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、又はグルクロン酸残基を意味する。

グループB;ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-6 アルキル基、ハロゲン化C1-6 アルキル基、C1-6 アルカノイル基、 $-(CH_2)_r - COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r - COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r - COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r - NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r - NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r - NR^{b1} - COR^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r - NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r - OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r - SR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r - SO_2R^{b1}$ 及び $-(CH_2)_r - SO_2NR^{b1}R^{b2}$ 。

ここで R^{11} 及び R^{12} は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6 アルキル基を意味し、rは0又は1万至6の整数である。

 $(8) - CONR^{a2}R^{a3}$

ここでR^{a2}及びR^{a3}は、それぞれ独立して、水素原子、C1-6アルコキシ基又は 置換されてもよいC1-6アルキル基(前記定義の通り。)を意味する。

 $(9) - C (= N R^{a4}) N H_2$

ここでR^{et}は、水素原子又は水酸基を意味する。

 $(10) - NHR^{a5}$

ここでR^{a5}は、水素原子、C1-6アルカノイル基又はC1-6アルキルスルホニル 基を意味する。

 $(11) - OR^{a6}$

ここでR^{a6}は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基(前記定義の通り。)を意味する。

 $(12) - SO_2R^{a7}$

ここでR^{a7}は、水酸基、アミノ基、C1-6アルキル基又はC1-6アルキルアミノ 基を意味する。

 $(13) - P (= O) (O R^{a31})_2$

ここで R^{a31} は、水素原子、置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)又は前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基を意味する。

又は、

(14)酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を

含んでなるヘテロ環基であり、

 R^7 及び R^8 は、水素原子又は置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)であり、

環Cyは、

(1)下記グループCから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基、

グループ C;水酸基、ハロゲン原子、C1-6 アルキル基及び C1-6 アルコキシ基。 (2) 前記グループ C から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8 シクロアルケニル基又は、

(3)

(式中、u及びvは、それぞれ独立して1乃至3の整数を表す。)であり、 環Aは、

- (1) C6-14 アリール基、
- (2) C3-8 シクロアルキル基、
- (3) C3-8 シクロアルケニル基、又は、
- (4)酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1万至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

R⁵及びR⁶は、それぞれ独立して、

- (1)水素原子、
- (2)ハロゲン原子、
- (3) 置換されてもよいC1-6アルキル基(前記定義の通り。)、又は、
- $(4) OR^{a8}$

ここでR⁻⁸は、水素原子、C1-6アルキル基又はC6-14アリールC1-6アルキル基を意味する。

であり、

Xは、

- (1)水素原子、
- (2)ハロゲン原子、
- (3)シアノ基、
- (4)ニトロ基、
- (5)アミノ基、C1-6アルカノイルアミノ基、
- (6) C1-6 アルキルスルホニル基、
- (7) 置換されてもよいC1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、
- (8)前記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC2-6 アルケニル基、
- $(9) COOR^{a9},$

ここでR³³は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。

(10) - CONH - (CH₂)₁ - R^{a10}

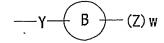
ここで R^{a10} は、置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)、C1-6 アルコキシカルボニル基又はC1-6 アルカノイルアミノ基であり、1 は、0 又は 1 乃至 6 の整数を意味する。

 $(11) - OR^{all}$

ここで R^{all} は、水素原子又は置換されてもよいC1-6Tルキル基(前記定義の通り。)を意味する。

又は、

(12)



{式中、環Bは、

- (1') C6-14 アリール基、
- (2') C3-8 シクロアルキル基、又は、
- (3')~テロ環基(前記定義の通り。)であり、

Zは、それぞれ独立して、

- (1')下記グループDから選ばれる基、
- (2')下記グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリール基、
- (3')下記グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 3-8シクロアルキル基、
- (4')下記グループDから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリールC1-6 アルキル基、
- (5')下記グループDから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選ばれる1万至 4個のヘテロ原子を含む。

又は、

(6')下記グループDから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、

ここで当該ヘテロ環C1-6アルキル基は、前記定義の通りの「グループDから 選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換されたC1-6 アルキル基を意味する。

であり、

グループD:

- (a)水素原子、
- (b) ハロゲン原子、
- (c)シアノ基、
- (d) ニトロ基、
- (e) 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、
- $(f) (CH_2)_+ COR^{a18}_-$

以下、t は、それぞれ独立して、0 又は1 乃至6 の整数を意味する。ここで R^{a18} は、

- (1'')置換されてもよいC1-6アルキル基(前記定義の通り。)、
- (2'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい

C6-14アリール基、又は、

(3'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい ヘテロ環基、

ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至 4個のヘテロ原子を含む。

であり、

 $(g) - (CH_2)_t - COOR^{a19}$

ここでR^{a19}は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基(前記定義の通り。)又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基C1-6アルキル基を意味する。

(h) $- (CH_2)_t - CONR^{a27}R^{a28}$

ここでR²²⁷及びR²²⁸は、それぞれ独立して、

- (1'')水素原子、
- (2'') 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、
- (3'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基、
- (4'')前記グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリールC1-6 アルキル基、
- (5'')前記グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよい ヘテロ環基、
- (6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい ヘテロ環C1-6アルキル基、

ここで当該ヘテロ環C1-6アルキル基は、前記定義の通りの「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換されたC1-6アルキル基を意味する。

- (7'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい C3-8シクロアルキル基、
- (8'') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8 シクロアルキル C1-6 アルキル基、

- (9'') 水酸基、又は、
- (10'') C1-6 アルコキシ基であり、
- $(i) (CH_2)_t C (= NR^{a33}) NH_2$

ここで R^{833} は、水素原子、C1-6 アルキル基、水酸基又はC1-6 アルコキシ基を意味する。

- $(j) (CH_{7})_{t} OR^{a20}$
- ここでR²²⁰は、
 - (1'')水素原子、
 - (2'') 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、
 - (3'') 置換されてもよい C2-6 アルケニル基 (前記定義の通り。)、
- (4'')前記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよい C2-6 アルキニル基、
- (5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい C6-14アリール基、
- (6'')前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基、
- (7'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい ヘテロ環基、
- (8'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい ヘテロ環C1-6アルキル基、
- (9'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい C3-8シクロアルキル基、又は、
- (10'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい C3-8シクロアルキルC1-6アルキル基であり、
 - (k) (C H₂)_t O (C H₂)_p C O R^{a21}

ここで R^{21} は、アミノ基、C1-6 アルキルアミノ基又は前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、pは 0 又は 1 乃至 6 の整数を意味する。

 $(1) - (CH_2)_t - NR^{a22}R^{a23}$

ここでR^{a22}及びR^{a23}は、それぞれ独立して、

- (1'')水素原子、
- (2'') 置換されてもよい C1-6 アルキル基(前記定義の通り。)、
- (3'')前記グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基、
- (4'')前記グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリールC1-6 アルキル基、
- (5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい ヘテロ環C1-6アルキル基、又は、
- (6'')前記グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよい ヘテロ環基であり、
 - $(m) (CH_2)_t NR^{a29}CO R^{a24}$

ここで R^{a29} は、水素原子、C1-6 アルキル基又はC1-6 アルカノイル基を意味し、

R a24 は、

- (1'')アミノ基、
- (2'') C1-6 アルキルアミノ基、
- (3'') 置換されてもよい C1-6 アルキル基(前記定義の通り。)、
- (4'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基、
- (5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい ヘテロ環基、又は、
- (6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい $^{\sim}$ つテロ環C1-6 アルキル基、を意味する。
 - (n) $(CH_2)_t NR^{a29}SO_2 R^{a25}$,

ここでR^{a29}は前記定義の通りであり、R^{a25}は、水素原子、置換されてもよいC 1-6アルキル基(前記定義の通り。)、前記グループBから選ばれる1万至5個の 置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる 1万至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

(o) $- (CH_2)_t - S(O)_q - R^{a25}$

ここでR²²⁵は前記定義の通りであり、qは0、1又は2である。

 $(p) - (CH_2)_t - SO_2 - NHR^{a26}$

ここでR²²⁶は、水素原子、置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいへテロ環基を意味する。

及び、

(q)酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1万至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

wは、1乃至3の整数であり、

Yは、

- (1') 単結合、
- (2') C1-6 アルキレン、
- (3') C2-6 アルケニレン、
- $(4') (CH_2)_m O (CH_2)_n$

以下、m及びnは、それぞれ独立して、0又は1乃至6の整数を意味する。

- $(5') CO \$
- $(6') CO_2 (CH_2)_n$
- $(7') CONH (CH_2)_n NH$
- $(8') NHCO_2$
- (9')-NHCONH-
- $(10') O (CH_2)_n CO$
- $(11') O (CH_2)_n O$
- $(12') SO_2$
- $(13') (CH_2)_m NR^{a12} (CH_2)_n$

ここでRal2は、

- (1'')水素原子、
- (2'') 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、

(3'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリールC1-6 アルキル基、

(4'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基、

 $(5'') - COR^{b5}$

ここで R^{15} は、水素原子、置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5 個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基を意味する。

(6'')-COOR^{b5} (R^{b5}は前記定義の通り。)、又は、

(7'')-SO₂R^{b5} (R^{b5}は前記定義の通り。)、

(14')-NR^{a12}CO-(R^{a12}は前記の定義と同じ。)、

 $(15') - CONR^{a13} - (CH_2)_n -$

ここで R^{a13} は、水素原子、置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)又は前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基を意味する。

 $(16') - CONH - CHR^{al4} -$

ここでR^{*14}は、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基を意味する。

 $(17') - O - (CH_2)_m - CR^{a15}R^{a16} - (CH_2)_n -$

ここでR⁼¹⁵及びR⁼¹⁶は、それぞれ独立して、

(1'')水素原子、

(2'')カルボキシル基、

(3'') C1-6 アルキル基、

 $(4'') - OR^{b6}$

ここで R^{16} は、C1-6 アルキル基又はC6-14 アリールC1-6 アルキル基を意味する。

又は、,

 $(5'') - NHR^{b7}$

ここで R^{b7} は、水素原子、C1-6 アルキル基、C1-6 アルカノイル基又はC6-14 アリールC1-6 アルキルオキシカルボニル基を意味する。

であり、

更にRal5は、

(6'')

$$-(CH_2)_{\overline{n'}}$$
 B' (Z') w'

であってもよく、

ここでn'、環B'、Z'及びw'は、それぞれ上記n、環B、Z及びwと同義であり、それぞれn、環B、Z及びwと同一若しくは異なってもよい。

(18') $-(CH_2)_n$ $-NR^{a12}$ $-CHR^{a15}$ $-(R^{a12}$ 及び R^{a15} は、それぞれ前記定義の通り。)、

 $(19') - NR^{a17}SO_2 -$

ここでR^{a17}は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。

(20') $-S(O)_e$ $-(CH_2)_m$ $-CR^{a15}R^{a16}$ $-(CH_2)_n$ $-(eは0、1又は2であり、<math>R^{a15}$ 及び R^{a16} は、それぞれ前記定義の通り。)、又は、

(21') $-(CH_2)_m$ $-CR^{a15}R^{a16}$ $-(CH_2)_n$ $-(R^{a15}$ 及び R^{a16} は、それぞれ前記定義の通り。)

である。} である。]

- 2. G^1 、 G^2 、 G^3 、 G^4 、 G^5 、 G^6 、 G^7 、 G^8 及び G^9 のうち1乃至4個が窒素原子である請求項1記載のC型肝炎治療剤。
- G²がC(-R²)であり、G⁶が炭素原子である請求項2記載のC型肝炎治療
 剤。
- 4. G⁵が窒素原子である請求項2又は請求項3記載のC型肝炎治療剤。
- 5. 一般式[I]の

部位が、

からなる群より選ばれる縮合環である請求項1記載のC型肝炎治療剤。 6. 一般式[I]の

$$G^{2} - G^{1} - G^{8} - G^{7} - G^{6} - G^{5}$$

部位が、.

からなる群より選ばれる縮合環である請求項5記載のC型肝炎治療剤。

7. 下記一般式 [I-1] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその 塩を有効成分として含んで成る請求項6記載のC型肝炎治療剤。

$$R^{2}$$
 R^{3}
 R^{4}
 R^{4}
 R^{7}
 R^{7}
 R^{5}
 R^{6}
 R^{6}

(式中、各記号は請求項1記載の通りである。)

8. 下記一般式[I-2]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る請求項6記載のC型肝炎治療剤。

$$R^{2}$$
 R^{3}
 R^{4}
 R^{4}
 R^{5}
 R^{6}
 R^{6}

(式中、各記号は請求項1記載の通りである。)

9. 下記一般式 [I-3] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその 塩を有効成分として含んで成る請求項 6 記載の C型肝炎治療剤。

$$R^2$$
 N
 N
 R^5
 R^5
 R^6

(式中、各記号は請求項1記載の通りである。)

10. 下記一般式 [I-4] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る請求項6記載のC型肝炎治療剤。

$$\begin{array}{c|c}
R^2 & R^5 \\
R^3 & R^4 & Cy
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
R^5 & \\
R^6 & \\
\end{array}$$

(式中、各記号は請求項1記載の通りである。)

11. R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 のうち少なくとも1つが、カルボキシル基、-C OOR a1 、-CONR a2 R a3 、-SO $_2$ R a7 (R^{a1} 、 R^{a2} 、 R^{a3} 及び R^{a7} は請求項1記載の通りである。)、

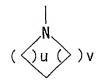
である請求項1乃至10のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

- 12. R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 のうち少なくとも1つが、カルボキシル基、-COO R^{a1} 、 $-CONR^{a2}R^{a3}$ 又は $-SO_2R^{a7}$ (R^{a1} 、 R^{a2} 、 R^{a3} 及び R^{a7} は請求項1記載の通りである。)である請求項11に記載のC型肝炎治療剤。
- 13. R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 のうち少なくとも1つが $-COOR^{a1}$ であり、 R^{a1} がグルクロン酸残基である請求項1乃至10のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。
- 14. R¹、<math>R²、R³及びR⁴のうち少なくとも1つが、酸素原子、窒素原子及

び硫黄原子から選ばれる1万至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基である 請求項1万至10のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

15. 環Cyが、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、 テトラヒドロチオピラニル基又はピペリジノ基である請求項1乃至14のいずれ かに記載のC型肝炎治療剤。

16. 環Cyが、



(式中、各記号は請求項1記載の通りである。)である請求項1乃至14のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

17. 環Aが、C6-14アリール基である請求項1乃至16のいずれかに記載の C型肝炎治療剤。

18. グループAによって置換されてもよい置換基のうち少なくとも何れか1つが、C1-6アルコキシC1-6アルコキシ基で置換された置換基である請求項1乃至17のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

19. Yが、 $-(CH_2)_m-CR^{al5}R^{al6}-(CH_2)_n-$ (各記号は、請求項1記載の通りである。) である請求項1乃至18のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

20. Zの少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基である請求項1乃至19のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

21. Zの少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で 置換されてもよい〜テロ環基であり、

(式中、 E^1 は酸素原子、硫黄原子又は $N(-R^{a35})$ であり、 E^2 は酸素原子、 CH_2 又は $N(-R^{a35})$ であり、 E^3 は酸素原子又は硫黄原子であり、ここで R^{a35} は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6 アルキル基であり、f は1 乃至 3 の整数であり、h 及びh はそれぞれ同一若しくは異なって1 乃至 3 の整数である。)である請求項1 乃至 1 9 のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

22. Zの少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で 置換されてもよいヘテロ環基であり、

(式中、各記号は請求項21記載の通りである。)である請求項21に記載のC型 肝炎治療剤。

- 23. グループDの少なくとも一つがー $(CH_2)_{t}$ ー $CONR^{a27}R^{a28}$ (各記号は、請求項1記載の通りである。)であり、 R^{a27} 及び R^{a28} の少なくとも何れか一方が、C1-6 アルコキシ基である請求項1乃至19のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。24. グループDの少なくとも一つがー $(CH_2)_{t}$ ー $C(=NR^{a33})NH_2$ (各記号は、請求項1記載の通りである。)であり、 R^{a33} が水酸基又はC1-6 アルコキシ基である請求項1乃至19のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。
- 25. グループDの少なくとも一つがー $(CH_2)_t$ ーOー $(CH_2)_p$ ーCOR a21 (各記号は、請求項1記載の通りである。)であり、 R^{a21} がアミノ基である請求項1 乃至19のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。
- 26. グループDの少なくとも一つがー $(CH_2)_t$ ーNR a29 COーR a24 (各記号は、請求項1記載の通りである。)であり、R a24 がアミノ基又はC1-6アルキルアミノ基である請求項1乃至19のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。
- 27. グループDの少なくとも一つがー $(CH_2)_t$ ーNR a22 R a23 (各記号は、請求項1記載の通りである。)であり、 R^{a22} 及び R^{a23} の少なくとも何れか一方が、グループBから撰ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基である請求項1乃至19のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。
- 28. グループDの少なくとも一つが、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から 選ばれる1万至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基である請求項1万至1 9のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。
- 29. 下記一般式[II]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

$$G^{2} - G^{1} - G^{8} - G^{7} - G^{6} - G^{5} - G^{5$$

[式中、

$$G^{2} G^{1} G^{8} G^{7} G^{6} G^{5}$$

部位は、

からなる群より選ばれる縮合環であり、

ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、それぞれ独立して、

- (1)水素原子、
- (2) C1-6 アルカノイル基、
- (3)カルボキシル基、
- (4)シアノ基、
- (5) ニトロ基、
- (6)下記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC1-6 アルキル基、

グループA;ハロゲン原子、水酸基、カルボキシル基、アミノ基、C1-6 アルコキシ基、C1-6 アルコキシC1-6 アルコキシ基、C1-6 アルコキシカルボニル基及びC1-6 アルキルアミノ基。

 $(7) - COOR^{a1}$

ここでR^{al}は、置換されてもよいC1-6アルキル基(前記定義の通り。)、下記

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、又はグルクロン酸残基を意味する。

グループB;ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-6アルキル基、ハロゲン化C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}-COR^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SO_2R^{b1}$ 及び $-(CH_2)_r-SO_2NR^{b1}R^{b2}$ 。

ここで R^{11} 及び R^{12} は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6 アルキル基を意味し、rは0又は1乃至6の整数である。

 $(8) - CONR^{a2}R^{a3}$

ここで R^{a2} 及び R^{a3} は、それぞれ独立して、水素原子、C1-6 アルコキシ基又は置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)を意味する。

 $(9) - C (= N R^{a4}) N H_2$

ここでR⁴は、水素原子又は水酸基を意味する。

 $(10) - NHR^{a5}$

ここで R^{a5} は、水素原子、C1-6 アルカノイル基又はC1-6 アルキルスルホニル基を意味する。

 $(11) - OR^{a6}$

ここで R^{a6} は、水素原子又は置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)を意味する。

 $(12) - SO_2R^{a7}$

ここで R^{a7} は、水酸基、アミノ基、C1-6アルキル基又はC1-6アルキルアミノ基を意味する。

 $(13) - P (= O) (O R^{a31})_2$

ここで R^{a31} は、水素原子、置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基を意味する。

又は、.

(14)酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を

含んでなるヘテロ環基であり、

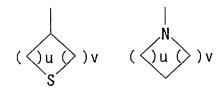
 R^7 は、水素原子又は置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)であり、

環Cy'は、

(1)下記グループCから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基

グループC;水酸基、ハロゲン原子、C1-6 アルキル基及びC1-6 アルコキシ基。 又は、

(2)



(式中、u及びvは、それぞれ独立して1乃至3の整数を表す。) であり、 環A は、

(1)フェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、シクロヘキシル基、シクロヘキセニル基、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれる基であり、

R⁵'及びR6'は、それぞれ独立して、

- (1)水素原子、
- (2) ハロゲン原子、
- (3)置換されてもよいC1-6アルキル基(前記定義の通り。)、又は、
- (4)水酸基

であり、

環Bは、

- (1) C6-14 アリール基、
- (2) C3-8 シクロアルキル基、又は、
- (3)酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1万至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

Zは、それぞれ独立して、

- (1)下記グループDから選ばれる基、
- (2)下記グループDから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、
- (3)下記グループDから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基、
- (4)下記グループDから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6アルキル基、又は、
- (5)下記グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、

ここで当該へテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1万至 4個のヘテロ原子を含む。

又は、

(6)下記グループDから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、

ここで当該ヘテロ環C1-6アルキル基は、前記定義の通りの「グループDから 選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換されたC1-6 アルキル基を意味する。

であり、

グループD:

- (a)水素原子、
- (b) ハロゲン原子、
- (c)シアノ基、
- (d) ニトロ基、
- (e) 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、
- $(f) (CH_2)_t COR^{al8}$,

以下、 t は、それぞれ独立して、0 又は1 乃至6 の整数を意味する。 ここで \mathbb{R}^{a18} は、

(1') 置換されてもよいC1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、

(2')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリール基、又は、

(3')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいへ テロ環基、

ここで当該へテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1万至 4個のヘテロ原子を含む。

であり、

 $(g) - (CH_2)_t - COOR^{a19}$

ここで R^{a19} は、水素原子、置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)又は前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリール基C1-6 アルキル基を意味する。

(h) $- (CH_2)_t - CONR^{a27}R^{a28}$,

ここでR^{a27}及びR^{a28}は、それぞれ独立して、

- (1')水素原子、
- (2') 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、
- (3')前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C 6-14 アリール基、
- (4')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基、
- (5')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいへ テロ環基、
- (6')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいへ テロ環C1-6アルキル基、

ここで当該へテロ環C1-6 アルキル基は、前記定義の通りの「前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいへテロ環基」で置換された C1-6 アルキル基を意味する。

- (7')前記グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいC 3-8シクロアルキル基、
 - (8')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC

3-8 シクロアルキルC1-6 アルキル基、

- (9')水酸基、又は、
- (10')C1-6アルコキシ基であり、
- $(i) (CH_2)_t C (= NR^{a33}) NH_2$

ここでR^{a33}は、水素原子、C1-6アルキル基、水酸基又はC1-6アルコキシ基を 意味する。

- $(j) (CH_2)_+ OR^{a20}_-$
- ここでR²²⁰は、
 - (1')水素原子、
 - (2')置換されてもよいC1-6アルキル基(前記定義の通り。)、
 - (3')置換されてもよいC2-6アルケニル基(前記定義の通り。)、
- (4')前記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC 2-6 アルキニル基、
- (5')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリール基、
- (6')前記グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基、
- (7')前記グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいへ テロ環基、
- (8')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいへ テロ環C1-6アルキル基、
- (9')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 3-8シクロアルキル基、又は、
- (10')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい C3-8シクロアルキルC1-6アルキル基であり、
 - $(k) (CH_2)_t O (CH_2)_p COR^{a21}$

ここで R^{a21} は、アミノ基、C1-6 アルキルアミノ基又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいへテロ環基であり、pは 0 又は 1 乃至 6 の整数を意味する。

(1) - (CH₂)_t - NR^{a22}R^{a23}

ここでR^{a22}及びR^{a23}は、それぞれ独立して、

- (1')水素原子、
- (2') 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、
- (3')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリール基、
- (4')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリール C1-6 アルキル基、
- (5')前記グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいへ テロ環C1-6アルキル基、又は、
- (6')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいへテロ環基であり、
 - $(m) (CH_2)_t NR^{a29}CO R^{a24}$

ここでR^{a29}は、水素原子、C1-6アルキル基又はC1-6アルカノイル基を意味 し、

R a24 は、

- (1')アミノ基、
- (2') C1-6 アルキルアミノ基、
- (3') 置換されてもよいC1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、
- (4')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリール基、
- (5')前記グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいへ テロ環基、又は、
- (6')前記グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよいへ テロ環C1-6アルキル基、を意味する。
 - $(n) (CH_2)_t NR^{a29}SO_2 R^{a25}$

ここで R^{a29} は前記定義の通りであり、 R^{a25} は、水素原子、置換されてもよい C^{1-6} アルキル基(前記定義の通り。)、前記グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されてもよい C^{6-14} アリール基又は前記グループBから選ばれる

1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

(o)
$$- (CH_2)_t - S(O)_q - R^{a25}$$
,

ここでR²²⁵は前記定義の通りであり、qは0、1又は2である。

 $(p) - (CH_2)_t - SO_2 - NHR^{a26}$

ここでR^{a26}は、水素原子、置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

及び、

(q)酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1万至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり

wは、1乃至3の整数であり、

Yは、

- (1) 単結合、
- (2) C1-6 アルキレン、
- (3) C2-6 アルケニレン、
- (4) (CH₂)_m O (CH₂)_n ,

以下、m及びnは、それぞれ独立して、0又は1乃至6の整数を意味する。

- (5) CO -
- $(6) CO_2 (CH_2)_n$
- (7) CONH (CH₂)_n NH -
- (8) NHCO₂-,
- (9) NHCONH-
- $(10) O (CH_2)_n CO -$
- $(11) O (CH_2)_n O$
- $(12) SO_2$
- (13) (CH₂)_m NR^{a12} (CH₂)_n ,

· ここでR^{a12}は、

(1')水素原子、

- (2') 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、
- (3')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基、
- (4')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14アリール基、
 - $(5') COR^{b5}$

ここで R^{15} は、水素原子、置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)、前記グループBから選ばれる1 乃至5 個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリール基又は前記グループBから選ばれる1 乃至5 個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基を意味する。

- (6')-COOR b5 (R b5 は前記定義の通り。)、又は、
- (7')-SO,R^{b5} (R^{b5}は前記定義の通り。)、
- (14)-NR^{a12}CO-(R^{a12}は前記の定義と同じ。)、
- $(15) CONR^{a13} (CH_2)_n$

ここで R^{a13} は、水素原子、置換されてもよいC1-6 アルキル基(前記定義の通り。)又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基を意味する。

 $(16) - CONH - CHR^{a14} -$

ここでR^{al4}は、前記グループBから選ばれる1万至5個の置換基で置換されて もよいC6-14アリール基を意味する。

- $(17) O (C H_2)_m C R^{al5} R^{al6} (C H_2)_n$
 - ここでRal5及びRal6は、それぞれ独立して、
 - (1')水素原子、
 - (2')カルボキシル基、
 - (3') C1-6 アルキル基、
 - $(4') OR^{6}$

ここで R^{16} は、C1-6 アルキル基又はC6-14 アリールC1-6 アルキル基を意味する。

又は、

$(5') - NHR^{b7}$

ここで R^{b7} は、水素原子、C1-6 アルキル基、C1-6 アルカノイル基又はC6-14 アリールC1-6 アルキルオキシカルボニル基を意味する。

であり、

更にR^{a15}は、

(6')

$$-(CH_2)_{\overline{n'}}$$
 B' (Z') w'

であってもよく、

ここでn'、環B'、Z'及びw'は、それぞれ上記n、環B、Z及びwと同義であり、それぞれn、環B、Z及びwと同一若しくは異なってもよい。

(18) - (CH₂)_n - NR^{a12} - CHR^{a15} - (R^{a12}及びR^{a15}は、それぞれ前記定義の通り。)、

 $(19) - N R^{a17} S O_2 -$

ここでR^{al7}は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。

(20) $- S(O)_e - (CH_2)_m - CR^{a15}R^{a16} - (CH_2)_n - (eは0、1又は2であり、R^{a15}及び<math>R^{a16}$ は、それぞれ前記定義の通り。)、又は、

(21) $-(CH_2)_m$ $-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n$ $-(R^{a15}及びR^{a16}$ は、それぞれ前記定義の通り。)

である。]

30. 下記一般式 [II-1] で表される請求項29記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

$$R^{2}$$
 R^{3}
 R^{4}
 R^{4}
 R^{5}
 R^{6}
 R^{6}
 R^{6}
 R^{6}

(式中、各記号は請求項29記載の通りである。)

31. 下記一般式 [II-2] で表される請求項29記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

$$R^{2}$$
 R^{3}
 R^{4}
 R^{4}
 $R^{6'}$
 $R^{6'}$
 $R^{6'}$
 $R^{6'}$
 $R^{6'}$
 $R^{6'}$

(式中、各記号は請求項29記載の通りである。)

32. 下記一般式 [II-3] で表される請求項29記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

$$R^2$$
 N
 N
 $R^{5'}$
 $R^{6'}$
 $R^{6'}$
 $R^{6'}$
 $R^{6'}$
 $R^{6'}$

(式中、各記号は請求項29記載の通りである。)

33. 下記一般式 [II-4] で表される請求項29記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

$$R^{2}$$
 R^{3}
 R^{3}
 $R^{5'}$
 $R^{6'}$
 $R^{6'}$
 $R^{6'}$
 $R^{6'}$
 $R^{6'}$

(式中、各記号は請求項29記載の通りである。)

34. R¹、R²、R³及びR⁴のうち少なくとも1つが、カルボキシル基、-C OOR^{a1}、-CONR^{a2}R^{a3}、-SO₂R^{a7} (R^{a1}、R^{a2}、R^{a3}及びR^{a7}は請求項2⁹記

載の通りである。)、

である請求項29乃至33のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

- 35. R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 のうち少なくとも1つが、カルボキシル基、-COO R^{a1} 又は $-SO_2R^{a7}$ (ここで R^{a1} 及び R^{a7} は請求項29記載の通り。)である請求項34に記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。
- 36. R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 のうち少なくとも1つが、カルボキシル基又は一 $COOR^{a1}$ (ここで R^{a1} は請求項29記載の通り。) である請求項35記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。
- 37. R²がカルボキシル基であり、R¹、R³及びR⁴が水素原子である請求項36記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。
- 38. R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 のうち少なくとも1つが $-COOR^{a1}$ であり、 R^{a1} がグルクロン酸残基である請求項29乃至33のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。
- 39. R¹、R²、R³及びR⁴のうち少なくとも1つが、酸素原子、窒素原子及 び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基である 請求項29乃至33のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその 塩。
- 40. 環Cy'が、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基 又はテトラヒドロチオピラニル基である請求項29乃至39のいずれかに記載の 縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。
- 41. 環Cy'が、シクロペンチル基、シクロヘキシル基又はシクロヘプチル 基である請求項40記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。
- 42. 環Cy'が、



(式中、各記号は請求項29記載の通りである。)である請求項29乃至39のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

43. 環A'が、フェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基又はピリダジニル基である請求項29乃至42のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

44. 環A'が、フェニル基又はピリジル基である請求項43記載の縮合環化 合物又は製薬上許容されるその塩。

45. 環A'が、フェニル基である請求項44記載の縮合環化合物又は製薬上 許容されるその塩。

46. グループAによって置換されてもよい置換基のうち少なくとも何れか1つが、C1-6アルコキシC1-6アルコキシ基で置換された置換基である請求項29 乃至45のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

47. Yが、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ 、 $-NHCO_2-$ 、 $-CONH-CHR^{a14}-$ 、 $-(CH_2)_m-NR^{a12}-(CH_2)_n-$ 、 $-CONR^{a13}-(CH_2)_n-$ 、 $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ 又は $-(CH_2)_n-NR^{a12}-CHR^{a15}-$ (ここで各記号は請求項29記載の通り。)である請求項29乃至46のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

48. Yが、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ 又は $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16} (CH_2)_n-$ (ここで各記号は請求項29記載の通り。) である請求項47記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

49. Yが、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-($ ここで各記号は請求項29記載の通り。)である請求項48記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

50. Yが、 $-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ (各記号は、請求項29記載の通りである。)である請求項29乃至46のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

51. R^2 がカルボキシル基であり、 R^1 、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、環C y がシクロペンチル基、シクロヘキシル基又はシクロヘプチル基であり、環A がフェニル基である請求項29乃至50のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

- 52. Zの少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基である請求項29乃至51のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。
- 53. Zの少なくとも一つが、グループDから選ばれる1万至5個の置換基で 置換されてもよいヘテロ環基であり、

(式中、 E^1 は酸素原子、硫黄原子又は $N(-R^{a35})$ であり、 E^2 は酸素原子、 CH_2 又は $N(-R^{a35})$ であり、 E^3 は酸素原子又は硫黄原子であり、ここで R^{a35} は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6 アルキル基であり、f は 1 乃至 3 の整数であり、h 及びh はそれぞれ同一若しくは異なって 1 乃至 3 の整数である。)である請求項 2 9 乃至 5 1 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。5 4 . Z の少なくとも一つが、グループ D から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、

(式中、各記号は請求項53記載の通りである。)である請求項53に記載の縮合 環化合物又は製薬上許容されるその塩。

- 5 5. グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_+-CONR^{a27}R^{a28}$ (各記号は、請求項 2 9 記載の通りである。)であり、 R^{a27} 及び R^{a28} の少なくとも何れか一方が、C1-6 アルコキシ基である請求項 2 9 乃至 5 1 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。
- 56. グループDの少なくとも一つがー $(CH_2)_t$ ー $C(=NR^{a33})NH_2$ (各記号は、請求項29記載の通りである。)であり、 R^{a33} が、水酸基又はC1-6アルコキシ基である請求項29乃至51のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。
- 57. グループDの少なくとも一つがー $(CH_2)_t$ ーOー $(CH_2)_p$ ー COR^{a21} (各記号は、請求項29記載の通りである。)であり、 R^{a21} が、アミノ 基である請求項29乃至51のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。58. グループDの少なくとも一つがー $(CH_2)_t$ ー $NR^{a29}CO-R^{a24}$ (各記号は、請求項29記載の通りである。)であり、 R^{a24} が、アミノ 基又はC1-6 アルキ

ルアミノ基である請求項29乃至51のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬 上許容されるその塩。

- 59. グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-NR^{a22}R^{a23}$ (各記号は、請求項29記載の通りである。)であり、 R^{a22} 及び R^{a23} の少なくとも何れか一方が、アミノ基又はC1-6アルキルアミノ基である請求項29乃至51のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。
- 60. グループDの少なくとも一つが、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から 選ばれる1万至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基である請求項29万至 51のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。
- 61. 2- [4-(3-ブロモフェノキシ) フェニル] -1-シクロヘキシル ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、
- 2- [4-(3-ブロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾ イミダゾール-5-カルボン酸、
- 2- [4-(2-ブロモ-5-クロロベンジルオキシ)フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

- 2-[4-(2-) 1 2-5-) 2-5-) 2-5- クロヘキシルベンゾイミダゾール-5- カルボン酸エチルエステル、
- $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー<math>5-$ カルボン酸、
- 1-シクロヘキシルー2- $\{4-[(E)-2-$ フェニルビニル] フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸エチルエステル、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[(E)-2-フェニルビニル]$ フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボキサミド、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-シアノー1-シクロペンチルベン ブイミダブール、

 $2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾー <math>\nu-5-\mu$ ルボキサミドオキシム、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[\{4-(4-7) ルオロフェニル)-2- メチル-5-チアゾリル\} メトキシ] フェニル<math>\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸エチルエステル、

 $2-\{4-[$ ビス(3-フルオロフェニル) メトキシ]-2-フルオロフェニル $\}-1-$ シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

 $2-\{4-[$ ビス(3-フルオロフェニル) メトキシ]-2-フルオロフェニル) -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンゾイルアミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾ -ル-5-カルボン酸エチルエステル、

2-(4-ベンゾイルアミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-(3-クロロフェニル)フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4-(3-アセトキシフェニルオキシ)フェニル] -1-シクロヘキシ

ルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸エチルエステル、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-ヒドロキシフェニルオキシ)フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[3-(4-llu)]$ ジルメトキシ)フェニルオキシ]フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー 5-カルボン酸エチルエステル、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[3-(4-ピリジルメトキシ) フェニルオキシ] フェニル<math>\}$ ベンゾイミダゾールー 5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール、

 $2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾー <math>\nu-5-$ カルボン酸エチルエステル、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルーN, N-ジメチルベンゾイミダゾール-5-カルボキサミド、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-N-メトキシ-N-メチルベンゾイミダゾール-5-カルボキサミド、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルー<math>5-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)ベンゾイミダゾール、

5-アセチル-2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル<math>-N-(2-ジメ チルアミノエチル) ベンゾイミダゾール-5-カルボキサミド 二塩酸塩、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-5-ニトロベン ゾイミダゾール、

5-アミノー2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベン ゾイミダゾール 塩酸塩、

5-アセチルアミノー2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルー<math>5-メタンスルホニルアミノベンゾイミダゾール、

5-スルファモイルー2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペン チルベンゾイミダゾール、

2-[4-(4-tert-ブチルベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4-(4-カルボキシベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチ ルベンブイミダブール-5-カルボン酸、

2-[4-(4-0) ロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[(2-クロロ-5-チェニル) メトキシ] フェニル\} -1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

1ーシクロペンチルー2ー[4ー(4ートリフルオロメチルベンジルオキシ) フェニル]ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-メトキシベンジルオキシ)フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-ピリジルメトキシ)フェニル]ベンゾ イミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

1-シクロペンチルー 2-[4-(4-メチルベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾールー 5-カルボン酸、

[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾ -ル-5-イル] カルボニルアミノ酢酸、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -3-シクロペンチルベンゾイミダゾー ル-5-カルボン酸、

2- [4-(ベンゼンスルホニルアミノ)フェニル]-1-シクロペンチルベ

ンゾイミダゾールー:5-カルボン酸、

1ーシクロペンチルー2ー [4ー(3,5ージクロロフェニルカルボニルアミノ)フェニル]ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

 $2-\{4-[(4-tert-ブチルフェニル) カルボニルアミノ] フェニル\}$ -1-シクロペンチルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[(4-ベンジルオキシフェニル) カルボニルアミノ] フェニル }-1-シクロペンチルベンゾイミダゾールー<math>5-$ カルボン酸、

 ${\rm t\ r\ a\ n\ s} - 4 - [2 - (4 - {\it ilde v}) {\it ilde v} {\it ilde v} {\it ilde v} + {\it ilde v} {\it ilde v} - {\it ilde v} {\it ilde v} + {\it ilde v$

trans-1-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル]-4-メトキシシクロヘキサン、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシメチルー<math>1-シクロペンチルベンゾイミダゾール、

2-[(4-シクロヘキシルフェニル) カルボニルアミノ]-1-シクロペンチルベンブイミダブール-5-カルボン酸、

1ーシクロペンチルー2ー[4ー(3,5ージクロロベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(3, 4-ジクロロベンジルオキシ)フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(フェニルカルバモイルアミノ)フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチルー 2-[4-(ジフェニルメトキシ)フェニル] ベンゾイミダゾールー<math>5-カルボン酸、

1-シクロペンチルー2-(4-フェネチルオキシフェニル)ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

t r a n s - 1 - [2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 5 - カルボキシベンゾイミダゾール<math>-1 - 1 - 1 - 4 - t e r t - プチルシクロヘキサン、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -5-カルボキシメトキシ-1-シクロペンチルベンブイミダブール、

2-(4-ベンジルアミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾー <math>n-5-カルボン酸、

2-[4-(N-ベンゼンスルホニル-N-メチルアミノ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(N-ベンジル-N-メチルアミノ) フェニル] <math>-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー 2-(4-フェネチルフェニル) ベンゾイミダゾールー 5-カルボン酸、

1ーシクロヘキシルー2ー[4ー(3,5ージクロロベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

1-シクロへキシルー 2-[4-(ジフェニルメトキシ)フェニル] ベンゾイミダゾールー<math>5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー 2-[4-(3,5-ジ-tert-ブチルベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾールー<math>5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-(4-メチルシクロヘキシル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $1-シクロヘキシルー2-{4-[2-(2-ナフチル) エトキシ] フェニル}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー2-[4-(1-t)フチル)メトキシフェニル] ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー 2-[4-(ジベンジルアミノ) フェニル] ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

2-[4-(2-ビフェニリルメトキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾー <math>n-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシルー2-[4-(ジベンジルメトキシ)フェニル]ベンゾイ

ミダゾールー5-カルボン酸、

2-(4-ベンゾイルメトキシフェニル)-1-シクロヘキシルベンゾイミダ ゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3, 3-ジフェニルプロピルオキシ)フェ ニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4-(3-クロロ-6-フェニルベンジルオキシ)·フェニル] -1-シ クロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロへキシル $-2-\{4-[2-(フェノキシ) エトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール<math>-5-$ カルボン酸、

1-シクロへキシルー2ー [4-(3-)フェニルプロピルオキシ) フェニル ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1ーシクロへキシルー2ー [4ー(5ーフェニルペンチルオキシ)フェニル] ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

2-(2-ベンジルオキシ-5-ピリジル)-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $1-シクロへキシルー2-{4-[2-(3,4,5-トリメトキシフェニル) エトキシ]フェニル<math>}$ ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -1- (4, 4-ジメチルシクロヘキシル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー2ー $\{4-[2-(1-ナフチル)$ エトキシ]フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

2- [4-(2-ベンジルオキシフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシ ルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(3-ベンジルオキシフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー2-[4-(2-ヒドロキシフェノキシ)フェニル] ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シク.ロヘキシル-2-[4-(3-ヒドロキシフェノキシ)フェニル] ベ ンゾイミダゾール-5-カルボン酸、 1-シクロへキシルー2-[4-(2-メトキシフェノキシ)フェニル]ベン ゾイミダゾールー<math>5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-メトキシフェノキシ)フェニル] ベンゾイミダゾール<math>-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシルー 2-[4-(2- プロポキシフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾールー <math>5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-プロポキシフェノキシ)フェニル]ベ ンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[2-(3-$ メチルー2-ブテニルオキシ)フェノキシ]フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-イソペンチルオキシフェノキシ)フェ ニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-イソペンチルオキシフェノキシ)フェ ニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[2-(10,11-ジヒドロ-5H-ジベング [b,f] アゼピン-5-イル) エトキシ] フェニル<math>\}$ ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [ビス (4-クロロフェニル) メトキシ] フェニル} -1-シクロ ヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[2-(4-メトキシフェニル)$ エトキシ] フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[2-(2-メトキシフェニル)$ エトキシ] フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロヘキシルー2- $\{4-$ [2-(3-メトキシフェニル) エトキシ] フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロヘプチルベンゾイミダゾー <math>\nu-5-$ カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-フェネチルオキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-フェネチルオキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2, 2-ジフェニルエトキシ)フェニル]· ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

cis-1-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾ イミダゾールー<math>1-4ル]-4-フルオロシクロヘキサン、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-フェノキシフェノキシ)フェニル] ベ ンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-フェノキシフェノキシ)フェニル] ベ ンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[(2R)-2-ベンジルオキシカルボニルアミノー2-フェニルエトキシ]フェニル\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー<math>5-$ カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{2-フルオロ-4-[2-(4-トリフルオロメ チルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン 酸、

2-[4-(4-ベンジルオキシフェノキシ) フェニル] -1-シクロヘキシ ルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[$ ビス (4-メチルフェニル) メトキシ] フェニル $\}-1-$ シクロヘキシルベンブイミダブール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[$ ビス(4-フルオロフェニル) メトキシ] フェニル $\}-1-$ シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-6-メトキシ-2-[4-(3-フェニルプロポキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シク.ロヘキシル-6-ヒドロキシ-2-[4-(3-フェニルプロポキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、 1-シクロヘキシル-6-メチル-2-[4-(3-フェニルプロポキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[2-(2-ベンジルオキシフェニル) エトキシ] フェニル <math>\}-1$ -シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[2-(3-ベンジルオキシフェニル) エトキシ] フェニル <math>\}-1$ -シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

2- [4-(2-カルボキシメチルオキシフェノキシ)フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4-(3-カルボキシメチルオキシフェノキシ)フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[3-000-6-(4-x)]$ フェニル[3-000-6-(4-x)] フェニー[3-000-6-(4-x)] フェーカルボン酸

 $2-\{4-[3-クロロ-6-(4-メトキシフェニル) ベンジルオキシ] フェニル <math>\{-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

1-シクロヘキシル-2-{2-メチル-4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[2-(4-tert-ブチルフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]フェニル\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー<math>5-$ カルボン酸、

 $2-\{4-[$ ビス(4-フルオロフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル $\}-1-$ シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-(4-ベンジルオキシフェノキシ)-2-クロロフェニル\}-1-$ シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-(4-ベンジルオキシフェノキシ)-2-トリフルオロメチルフェ$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-クロロ-6-(2-トリフルオロメチルフェニル)ベンジル

オキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[(2R)-2-アミノ-2-フェニルエトキシ]$ フェニル $\}-1-$ シクロへキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(3-ビフェニリルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベン ゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[2-\{(1-tert-ブトキシカルボニルー4-ピペリジル) メトキシ\}$ フェノキシ] フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[3-\{(1-tert-ブトキシカルボニルー4-ピペリジル) メトキシ\}$ フェノキシ]フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[3-クロロ-6-(3,4,5-トリメトキシフェニル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (2-ビフェニリル) エトキシ] フェニル} -1-シクロへ キシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(2-ビフェニリルメトキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー<math>5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[2-(4-ll)]$ ジルメトキシ)フェノキシ] フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸 塩酸塩、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-ピペリジルメトキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸塩酸塩、

 $2-\{4-[(2R)-2-アセチルアミノー2-フェニルエトキシ] フェニル}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[3-(4-メチルー3-ペンテニルオキシ)$ フェノキシ]フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロヘキシルー2ー {4-[3-(3-メチルー3-ブテニルオギシ)

フェノキシ フェニル ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

 $2-\{4-[\{(2S)-1-ベンジル-2-ピロリジニル\} メトキシ] フェニル\} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、$

 $2-\{4-[3-\rho pp-6-(2-fr-n)]$ ベンジルオキシ] フェニル $\}$ -1-シ pp-4 アングイミダゾールー5-pp-4 アングルボン酸、

 $2-\{4-[3-\rho pp-6-(3-\rho pp-2x=n) ベンジルオキシ] フェニル\} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー<math>5-$ カルボン酸、

2-{4-[3-クロロ-6-(3-ピリジル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[3-\rho pp-6-(4-7) ルオ pp-2 pp-6-(4-7) ルオ pp-6-(4-7)$

2-[4-(4-ベンジルオキシフェノキシ)-3-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4-(2-ブロモー5-クロロベンジルオキシ)フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[3-\rho pp-6-(4-\rho pp-2x=n)]$ ベンジルオキシ]-2 ーフルオpp-2x=n $\}$ ー1-シクpへキシルベンゾイミダゾールー5 ーカルボン酸、

 $2-\{4-[2-\{(1-rセチル-4-ピペリジル) メトキシ\} フェノキシ]$ フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[3-\{(1-rセチル-4-ピペリジル) メトキシ\} フェノキシ]$ フェニル $\}-1-シ$ クロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロヘキシルー2ー $\{4-[3-(2- プロピニルオキシ) フェノキシ]$ フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

1ーシクロヘキシルー2ー {4ー[3ー(3ーピリジルメトキシ) フェノキシ]

フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシー2-メトキシフェニル)-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(2-ブロモ-5-メトキシベンジルオキシ)フェニル]-1-シ クロヘキシルベンブイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4-(カルボキシジフェニルメトキシ)フェニル]-1-シクロヘキシ ルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-ニトロベンジルオキシ]フェニル\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

 $2-\{4-[3-アセチルアミノ-6-(4-クロロフェニル)$ ベンジルオキシ[7] フェニル[7] [

 $2-\{4-[2-(4-カルボキシフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]$ フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[\{(2S)-1-ベンジルオキシカルボニル-2-ピロリジニル\}$ メトキシ] フェニル $\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン$ 酸、

2- {2-クロロ-4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) ベンジル オキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $1-シクロへキシルー2-{4-[3-(2-ピリジルメトキシ)フェノキシ]$ フェニル $}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-フルオロベンジルオキシ]フェニル\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー<math>\dot{5}$ -カルボン酸、

 $2-\{4-[3-カルボキシ-6-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ]$ フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[3-カルバモイル-6-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ]$ フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(ジメチルカルバモイルメトキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1ーシクロヘキシルー2ー {4ー [2ー (ピペリジノカルボニルメトキシ) フ

ェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

 $2-\{4-[\{(2S)-1-ベンゼンスルホニルー2-ピロリジニル\} メトキシ] フェニル<math>\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[\{(2S)-1-ベンゾイル-2-ピロリジニル\} メトキシ] フェニル <math>\{-1-2$ クロヘキシルベンゾイミダゾールー $\{-1-2\}$

 $2-\{4-[2-(4-)ルバモイルフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]$ フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[3-(ジメチルカルバモイルメトキシ)フェノキシ]フェニル<math>\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[3-(ピペリジノカルボニルメトキシ)フェノキシ]フェニル<math>\}$ ベンゾイミダゾールー 5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[3-\{(1-$ メタンスルホニルー4-ピペリジル) メトキシ $\}$ フェノキシ]フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[\{2-メチルー5-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル\} メトキシ] フェニル<math>\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[\{(2S)-1-(4-=)$ トロフェニル)ー 2-ピロリジニル $\}$ メトキシ]フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[\{(2S)-1-(4-アセチルアミノフェニル)-2-ピロリジ$ =ル $\}$ メトキシ] フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

 $2-\{4-[$ ビス(3-フルオロフェニル) メトキシ] フェニル $\}-1-$ シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[2-(4-)$ クロロフェニル)-3-ニトロベンジルオキシ]フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[3-(4-\tau)]$ フェノキシ]フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー $5-\pi$ カルボン酸、

 $1-シクロへキシルー2-{4-[3-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)フェノキシ]フェニル<math>}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $1-シクロへキシル-2-\{4-[3-\{(1-メチル-4-ピペリジル)メトキシ\} フェノキシ] フェニル<math>\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[3-(4-tert-ブチルベンジルオキシ) フェノキシ] フェ$ $ニル<math>\}-1-シ$ クロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[3-(2-000 - 200$

1-シクロへキシルー2ー $\{4-[3-(3-)]$ ジル)フェノキシ]フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

 $1-シクロへキシルー2-{4-[3-(4-メトキシフェニル)フェノキシ]$ フェニル $}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[\{4-(4-)$ 4クンスルホニルフェニル)ー 2- メチルー5-5 ーチアゾリル $\}$ メトキシ]フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[1-(4-クロロベンジル)-3-ピペリジルオキシ]$ フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー2ー $\{4-[3-\{(2-メチルー4-チアブリル) メトキシ\}$ フェノキシ]フェニル $\}$ ベンゾイミダブールー5-カルボン酸、

 $1-シクロヘキシル-2-{4-[3-{(2,4-ジメチル-5-チアゾリル)}$ メトキシ} フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(3,5-ジクロロフェニル)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

 $2-\{4-[3-(4-\rho uuべンジルオキシ) ピペリジノ] フェニル<math>\}-1$ ーシクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[4-カルバモイル-2-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ]$ フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[4-(4-クロロベンジルオキシ)ピペリジノ]フェニル}-1 -シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[\{(2S)-1-(4-ジメチルカルバモイルフェニル)-2-ピロリジニル\} メトキシ] フェニル<math>\}-1-シ$ クロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェ ニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[\{4-(4-ジメチルカルバモイルフェニル)-2-メチルー5-チアゾリル\} メトキシ] フェニル<math>\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

2-[4-(4-ベンジルオキシ-6-ピリミジニルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1ーシクロヘキシルー2ー {4ー [4ー (4ーピリジルメトキシ) -6ーピリミジニルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-(2-) - 5 - t e r t -) + シカルボニルベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエ

ステル、

 $2-\{4-[5-tert-ブトキシカルボニルー2-(4-クロロフェニル)$ ベンジルオキシ]フェニル $\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸メチルエステル、$

 $2-\{4-[5-カルボキシ-2-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ]$ フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸メチルエステル 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチルカルバモイルベンジルオキシ]フェニル\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、$

 $2-\{4-[3-(tert-ブチルスルファモイル)-6-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

2-(4-ベンジルオキシシクロヘキシル)-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[2-(2-i)] -1-i
2- [2-(2-ビフェニリルオキシメチル)-5-フリル]-1-シクロへ キシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[{4-(4-カルボキシフェニル)-2-メ

チルー5ーチアゾリル}メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸塩酸塩、

1-シクロヘキシル-2-{2-フルオロ-4-[4-フルオロ-2-(3-フルオロベンゾイル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロへキシルー $2-\{4-[3-ジ$ メチルカルバモイルー5-(4-1) リジルメトキシ)フェノキシ]フェニル $\}$ ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸 二塩酸塩、

1ーシクロヘキシルー2ー {4ー[3ーカルボキシー5ー(4ーピリジルメトキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸 二塩酸塩、

 $2-\{4-[3-カルバモイル-6-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ]$ フェニル $\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、$

 $2-\{4-[\{2-(4-)\pi\pi+2)]$ -3-ピリジル $\}$ ++2] フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

1ーシクロヘキシルー2ー {4ー [3ージメチルカルバモイルー6ー (4ートリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸 塩酸塩、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-ジメチルカルバモイル-6-(4-メ チルチオフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カル ボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[3-カルバモイル-6-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ]$ $-2-フルオロフェニル\} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、$

 $2-\{4-[3-ジメチルカルバモイル-6-(4-メタンスルホニルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-$ カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[3-ジメチルカルバモイル-6-(3-ピリジル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

 $2-\{4-[3-ジメチルカルバモイル-6-(4-ジメチルカルバモイルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}-1-シ$ クロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メタンスルホニルベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-ジメチルアミノベンジルオキシ]フェニル\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(4-ヒドロキシピペリジノ)$ カルボニルベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル $\}-1-$ シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-モルホリノカルボニルベンジ ルオキシ]-2-フルオロフェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-チオモルホリノカルボニルベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

 $2-\{4-[3-(カルボキシメチルカルバモイル)-6-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

 $2-\{4-[2-\{4-(2-)\pinixキシエチル)]$ フェニル $\}-5-$ クロロベンジルオキシ]フェニル $\}-1-$ シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-クロロー6-(4-メトキシメチルフェニル) ベンジルオキシ フェニル -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[2-(3-カルボキシフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]$ フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチルチオベンジルオキシ]$ フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸、

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチルスルフィニルベンジルオキシ]フェニル\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

2-{4-[ビス (2-ピリジル) メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシ ルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[ビス(4-ジメチルカルバモイルフェニル)メトキシ]フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[ビス(2-チエニル)メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシ ルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

テル、

 $2-\{4-[5-カルボキシ-2-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ]$ $-2-フルオロフェニル\} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

 $2-\{4-[2-(4-カルバモイルフェニル)-5-(ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-$ カルボン酸、

 $2-\{4-[5-アミノー2-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

 $2-\{4-[$ ビス(4-カルボキシフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル $\}-1-$ シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[フェニル-3-ピリジルメトキシ]-2-フルオロフェニル}-

1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[5-クロロ-2-(4-ピリジル) ベンジルオキシ] フェニル\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[5-ジメチルアミノカルボニルー2-(4-ピリジル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸 二塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(4-)222222)-5-\{N-(3-222222)$ カルバモイル $\}$ ベンジルオキシ $\}$ フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

 $2-\{.4-[2-(4-)222222) -5-\{N-(2-22222) -5-\{N-(2-22222) -5-\{N-(2-22222) -2-2222 -2-222 -2-2222 -2-222 -2-222 -2-222 -2-222 -2-222 -2-222 -2-222 -2-222 -2-222$

ゾールー5ーカルボン酸 二塩酸塩、

 $2-\{4-[(4-フルオロフェニル)(4-カルボキシフェニル)メトキシ]$ $-2-フルオロフェニル\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(フェニルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、$

 $2-\{4.-[2-(4-クロロフェニル)-5-(4-メトキシピペリジノカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾー$

ルー5ーカルボン酸 塩酸塩、

2-[4-(2-ブロモ-5-ニトロベンジルオキシ)-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-ニトロベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

 $2-[4-\{5-アミノ-2-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ\} -2$ -フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン 酸メチルエステル、

2- [4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(2-オキソピロリジン-1 -イル) ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベン ゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- [4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(2-オキソピロリジン-1 -イル) ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベン ゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(4-メチルピペリジン-1$ -イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル $\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩$

2-{4-[5-アセチル-2-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-{(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル)メトキシ}ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $2-\{4-[2-(4-02222222)-5-(2-3)+キシエトキシ)$ ベンジルオキシ] フェニル $\}-1-シ$ 02つペキシルベンゾイミダゾールー5-3カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(4-\rho ppp z=n)-5-(3,4-ジヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル)ベンジルオキシ]フェニル<math>\}-1-シ\rho$ pベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-4-(イソプロピルカルバモイル)$ ベンジルオキシ]フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸 塩酸塩、

ゾイミダゾールー5ーカルボン酸 二塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(4-\rho ppp z=n)-4-(ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}-1-$ シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[5-(2-アミノチアゾール-4-イル)-2-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル <math>\}-1-シクロへキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、$

 $2-\{4-[5-(ジメチルカルバモイル)-2-(4-フルオロフェニル)$ ベンジルオキシ]フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[5-(ジメチルカルバモイル)-2-(3-フルオロフェニル)$ ベンジルオキシ]フェニル $\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、$

2- {4-[2-ブロモ-5-(5-メチルオキサゾール-2-イル)ベンジ

ルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-プロモー5-(5-メチルチアゾールー2-イル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸塩酸塩、

 $2-\{4-[5-クロロ-2-(4-シアノフェニル) ベンジルオキシ] フェニル <math>\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[5-クロロ-2-(4-テトラゾール-5-イルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、$

 $2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(N-ヒドロキシアミジノ)}$

ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダ ゾール-5 - カルボン酸 二塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(4-0107x=n))-5-(2,5-ジヒドロ-5-オ+ソ-4H-1,2,4-チアジアゾール-3-イル) ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸塩酸塩、$

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (メトキシカルバモイル) ベ

ンジルオキシ] -2 - フルオロフェニル} -1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾ - ル - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[5-(ブチルカルバモイル)-2-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、$

 $2-\{4-[2-(3,4-i)]$ ルカル 2-[4-[2-(3,4-i)] ルカル 2-[4-[2-(3,4-i)] 2-[4-[2-(3,4-i)]] 2-[4-[2-(3,4-i)]] 2-[4-[2-(3,4-i)]] 2-[4-[2-(3,4-i)]] 2-[4-[2-(3,4-i)]] 2-[4-[2-(3,4-i)]] 2-[4-(3,4-i)] 2-[4-(4,4-i)] 2

 $2-\{4-[2-(2,4-ジフルオロフェニル)-5-(イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、$

 $2-\{4-[2-(3,5-i)0122-i)-5-(4)12122-i)$ モイル) ベンジルオキシ] -2-122-i エーシクロヘキシルベン ブイミダゾール -5-12-i 塩酸塩、

2-{4-[2-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-5-(イソプロピルカルバモイル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸塩酸塩、

2-{4-[2-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-(イソプロピルカルバモイル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキ

シルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(4-\rho - 2-7 -$

2-{4-[2-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-5-(イソプロピルカルバモイル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸塩酸塩、

 $2-\{4-[2-\{4-(メチルチオ)]$ フェニル $\}$ -5-(2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ] $-2-フルオロフェニル<math>\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-\{4-(メチルチオ)]$ フェニル $\}$ -5-(イソプロピルカル バモイル) ベンジルオキシ] $-2-フルオロフェニル<math>\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4-[2-(4-クロロフェニル) -5-(4-ヒドロキシピペリジン

-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(イソプロピルカルバモイル)$ ベンジルオキシ]フェニル $\}-[1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、$

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(ピロリジン-1-イルカルボニル)ベンジルオキシ]フェニル<math>\}-1-(テトラヒドロチオピラン-4-イル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、$

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(2-イミダゾリン-2-イル) ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

 $2-\{4-[\{2-[\{(ジメチルカルバモイル) メトキシ\} メチル]-4-(4-1) + (4-1)$

 $2-\{4-[\{4-(4-7) ルオロフェニル)-2-(4-1) トーロー (4-1) トロー

 $2-\{4-[\{4-(4-7) + 2-1\}] - 2-[(3) + 2-1] + 2-1$

1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(4-カルボキシフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]$ $-2-フルオロフェニル\}-1-シクロヘキシル-5-テトラゾール-5-イルベンゾイミダゾール 塩酸塩、$

 $2-\{4-[5-カルボキシ-2-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ]$ $-2-フルオロフェニル\}-5-シアノ-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール、$

 $2-\{5-[$ ビス (3-フルオロフェニル) メチル]-2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル $\}-1-$ シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、 $2-\{3-[$ ビス (3-フルオロフェニル) メチル]-2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル $\}-1-$ シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、 $2-\{4-[(3-$ ジメチルカルバモイルフェニル) (4-フルオロフェニル) メトキシ]-2-フルオロフェニル $\}-1-$ シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[{3-(4-ヒドロキシピペリジル-1-イルカルボニル)フェニル}(4-フルオロフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $1-\{[2-\{4-(4-7) + 1-2-1] - 2-1 + 1-2-1] - 1-4-1 - 1-2-1 - 1$

 $\{[2-\{4-[ビス(3-フルオロフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー<math>5-$ イル]カルボニル $\}-\beta$ -D-グルクロン酸、

2- [4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(イソプロピルアミノカルボ

ニル) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシル-4-メトキシベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-[3-\{[4-(4-7) + 2-2] - 2-2 + 2-$

 $2-[4-\{2-(4-)222222)-5-[N-222222]$ スルホニル) アミノ] ベンジルオキシ $\}$ -2-フルオロフェニル] -1-シクロ ヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-(2-(4-)2122222)-5-[N-x+)-N-(x+) スルホニル) アミノ] ベンジルオキシ $\}-2-7$ ルオロフェニル] -1-シクロ ヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-(2-(4-クロロフェニル)-5-[N-(エチルカルボニル)-N-メチルアミノ]ベンジルオキシ<math>-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

ルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸 塩酸塩、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-1H-インドール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-シクロヘキシルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-7-カルボン酸エチルエステル、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-シクロヘキシルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-7-カルボン酸、

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル\}-3-シクロヘキシル-3H-イミダゾ <math>[4,5-b]$ ピリジン-6-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-ヒドロキシベンジルオキシ] フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(フェニルカルバモイル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-[4-\{5-アミノ-2-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ\}-2$ -フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン 酸メチルエステル、

2- {4-[5-アセチル-2-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル) ベンジルオキシ] フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-4-\{(4-ピリジルメチル) カルバモイル\} ベンジルオキシ] フェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、$

 $2-\{4-[5-(2-アミノチアゾール-4-イル)-2-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル <math>\}-1-シクロへキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、$

 $2-\{4.-[2-(4-クロロフェニル)-5-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルスルホニル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}-1-シクロへキシルベン$

ゾイミダゾールー5ーカルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[5-(ジメチルカルバモイル)-2-(4-フルオロフェニル)$ ベンジルオキシ]フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[5-(ジメチルカルバモイル)-2-(3-フルオロフェニル)$ ベンジルオキシ]フェニル $\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-プロモー5-(5-メチルオキサゾールー2-イル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸 塩酸塩、$

 $2-\{4-[2-プロモー5-(5-メチルチアゾールー2-イル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸塩酸塩、$

 $2-\{4-[5-\rho -2-(4-r)-j -1-v -5-l -1 -2-v -1 -2-v -1 -1$

ン酸塩酸塩、

ゾールー5ーカルボン酸 塩酸塩、

2- {4-[5-(ブチルカルバモイル)-2-(4-クロロフェニル)ベン

ジルオキシ] -2 - フルオロフェニル} -1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(3,4-ij)]$ 2-(4)

 $2-\{4-[2-(2,4-ジフルオロフェニル)-5-(イソプロピルカルバモイル).ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、$

 $2-\{4-[2-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(イソプロピルカルバモイル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、$

- 2-{4-[2-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-5-(イソプロピルカルバモイル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、
- 2-{4-[2-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-(イソプロピルカルバモイル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸塩酸塩、
- $2-\{4-[2-(4-\rho 2-\nu +

- $2-\{4-[2-\{4-(メチルチオ)]$ フェニル $\}$ -5-(2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ] $-2-フルオロフェニル<math>\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、
- $2-\{4-[2-\{4-(メチルチオ)]$ フェニル $\}$ -5-(イソプロピルカル バモイル) ベンジルオキシ] $-2-フルオロフェニル<math>\}$ -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、
- $2-\{4-[4-クロロ-2-(4-クロロフェニル)-5-(1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル) ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}$

-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[4-\rho -2-(4-\rho -2-1)-5-(2-\pi +2)]$ $2-\{4-[4-\rho -2-2-(4-\rho -2-1)-5-(2-\pi +2)]$ $2-\{4-[4-\rho -2-2-(4-\rho -2-1)-5-(2-\pi +2)]$ $2-\{4-[4-\rho -2-2-2-2-2]$ $2-\{4-[4-\rho -2-2-2-2]$ $2-\{4-[4-\rho -2-2-2]$ $2-\{4-[4-\rho -2-2-2]\}$ $2-\{4-[4-\rho -2-2]\}$ $2-[4-[4-\rho -2-2]]$ $2-[4-[4-\rho$

 $2-\{4-[2-(4-0107x=1)-5-(ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル<math>\}-1-$ シクロペンチルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(イソプロピルカルバモイル)$ ベンジルオキシ]フェニル $\}$ -1-(テトラヒドロチオピランー4-イル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(ピロリジン-1-イルカル

ボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-(テトラヒドロチオピラン-4-イル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(2-オキソオキサゾリジン -3-イル) ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシル ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-\{4-[2-(4-\rho pppper 2-1)] -5-(2-オキサゾリン-2-1)$ ルアミノ)ベンジルオキシ]-2-7ルオロフェニル]-1-9クロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

 $2-\{4-[\{4-(4-7) + 2-(3+7) + 2-(3+7) + 2-(4-$

 $2-\{4-[2-(4-カルボキシフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]$ $-2-フルオロフェニル\}-1-シクロヘキシル-5-テトラゾール-5-イルベンゾイミダゾール 塩酸塩、$

5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル) ベンゾイミダゾール 塩酸塩、

 $2 - \{4 - [5 - カルボキシ-2 - (4 - クロロフェニル) ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル \} - 5 - シアノ - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール、$

 $2-\{4-[\{N-(4-ジメチルカルバモイル)-N-(4-フルオロフェニル) アミノ\} メチル] フェニル<math>\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5$ -カルボン酸、

2-{5-[ビス(3-フルオロフェニル)メチル]-2-フルオロ-4-ヒ ドロキシフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{3-[ビス(3-フルオロフェニル)メチル]-2-フルオロ-4-ヒ ドロキシフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

 $1-\{[2-\{4-(4-7) + 1-2-7) - 2-7 + 1-$

 $\{[2-\{4-[ビス(3-フルオロフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル\}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-イル]カルボニル\}-\beta$ -D-グルクロン酸、

ヘキシルベンゾイミダゾールー5ーカルボン酸 塩酸塩、

 $3-\{[4-(5-r)]$ スルホニルー1-vクロヘキシルベンゾイミダゾールー2-4 ルー 3-7 ルオロフェノキシ] メチル1-4-(4-7) ロロフェニル1-1 トルーイソプロピルベンズアミド、

2- [4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-メチル-N-(メチル

スルホニル) アミノ] ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロ ヘキシルベンブイミダブール-5-カルボン酸 塩酸塩、

 $2-[4-\{2-(4-)2\pi2\pi2\pi)-5-(N-)7\pi2\pi\pi]$ $2-[4-\{2-(4-)2\pi2\pi2\pi)-5-(N-)7\pi2\pi\pi]$ $2-[4-\{2-(4-)2\pi2\pi2\pi]-5-(N-)7\pi2\pi]$ $2-[4-\{2-(4-)2\pi2\pi2\pi]-5-(N-)7\pi2\pi]$ $2-[4-\{2-(4-)2\pi2\pi2\pi]-5-(N-)7\pi2\pi]$ $2-[4-\{2-(4-)2\pi2\pi2\pi]-5-(N-)7\pi2\pi]$ $2-[4-\{2-(4-)2\pi2\pi2\pi]-1-(N-)7\pi2\pi]$ $2-[4-\{2-(4-)2\pi2\pi2\pi]-1-(N-)7\pi2\pi]$ $2-[4-\{2-(4-)2\pi2\pi2\pi]-1-(N-)7\pi2\pi]$ $2-[4-\{2-(4-)2\pi2\pi2\pi]-1-(N-)7\pi2\pi]$ $2-[4-(4-)2\pi2\pi2\pi]-1-(N-)7\pi2\pi]$ $2-[4-\{2-(4-)2\pi2\pi2\pi]-1-(N-)7\pi2\pi]$ $2-[4-(4-)2\pi2\pi2\pi]-1-(N-)7\pi2\pi]$ $2-[4-(4-)2\pi2\pi2\pi]-1-(N-)2\pi2\pi]$ $2-[4-(4-)2\pi2\pi2\pi]$ $2-[4-(4-)2\pi2\pi]$ -[4-(4

- 63. 請求項29乃至62のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る医薬組成物。
- 64. 請求項1乃至28又は29乃至62のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成るC型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤。
- 65. 請求項1乃至28又は29乃至62のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る抗C型肝炎

ウイルス剤。

66. 請求項29乃至62のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成るC型肝炎治療剤。

- 67. (a)請求項65に記載の抗C型肝炎ウイルス剤と、(b)他の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも1つの薬剤とを組み合わせてなる抗C型肝炎ウイルス剤。
- 68. (a)請求項65に記載の抗C型肝炎ウイルス剤と、(b)インターフェロンとを組み合わせてなる抗C型肝炎ウイルス剤。
- 69. (a)請求項64に記載のC型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤と、(b)他の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも1つの薬剤とを組み合わせてなるC型肝炎治療剤。
- 70. (a)請求項64に記載のC型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤と、(b) インターフェロンとを組み合わせてなるC型肝炎治療剤。
- 71. 下記一般式 [III] で表されるベンゾイミダゾール化合物又はその塩。

$$R^{a36}0 \xrightarrow{N} R^{a38} OH \qquad [III]$$

(式中、R^{a36}は水素原子又はカルボン酸保護基であり、R^{a37}はシクロペンチル基 又はシクロヘキシル基であり、R^{a38}は水素原子又はフッ素原子である。)

72. 4-(4-フルオロフェニル) -5-ヒドロキシメチルー2ーメチルチアゾール及び4-(4-フルオロフェニル) -5-クロロメチルー2ーメチルチアゾールからなる群より選ばれるチアゾール化合物又は製薬上許容されるその塩。73. 1-(4'-クロロー2ーヒドロキシメチルービフェニルー4ーイル) -2-ピロリジノン及び1-(4'-クロロー2ークロロメチルービフェニルー4ーイル) -2-ピロリジノンからなる群より選ばれるビフェニル化合物又は製薬上許容されるその塩。

74. (a)請求項1記載の一般式 [I]で表される縮合環化合物又は製薬上 許容されるその塩、及び(b)請求項1記載の化合物以外の抗ウイルス剤、抗炎

症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも1つの薬剤を含有する医薬組成物。

- 75. (a)請求項1記載の一般式 [I]で表される縮合環化合物又は製薬上 許容されるその塩、及び (b) インターフェロンを含有する医薬組成物。
- 76. 有効量の請求項1記載の一般式[I]で表される縮合環化合物又は製薬 上許容されるその塩を投与することを含む、C型肝炎の治療方法。
- 77. 有効量の、請求項1記載の化合物以外の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも1つの薬剤を投与することをさらに含む、請求項76記載の方法。
- 78. 有効量のインターフェロン投与することをさらに含む、請求項76記載の方法。
- 79. 有効量の請求項1記載の一般式[I]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を投与することを含む、C型肝炎ウイルスポリメラーゼの阻害方法。
- 80. 有効量の、請求項1記載の化合物以外の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも1つの薬剤を投与することをさらに含む、請求項79記載の方法。
- 81. 有効量のインターフェロン投与することをさらに含む、請求項79記載の方法。
- 82. C型肝炎治療用医薬を製造するための請求項1記載の一般式[I]で表 される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩の使用。
- 83. C型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤を製造するための請求項1記載の 一般式[I]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩の使用。
- 84. 請求項1記載の一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含有するC型肝炎治療用医薬組成物。
- 85. 請求項1記載の一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含有するC型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害用医薬組成物。
- 86. 請求項84記載の医薬組成物、及び該医薬組成物をC型肝炎の治療用途

に使用することができる、または使用すべきであることを記載した該医薬組成物 に関する記載物を含む商業パッケージ。

87. 請求項85記載の医薬組成物、及び該医薬組成物をC型肝炎ウイルスポリメラーゼの阻害用途に使用することができる、または使用すべきであることを記載した該医薬組成物に関する記載物を含む商業パッケージ。

International application No.
PCT/JP02/06405

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int.Cl ⁷ A61K31/4184, 31/4439, 31/42, 31/4523, 31/496, 31/55, 31/427, 31/506, 31/437, C07D235/18, 235/30, 409/12, 401/12, 413/12, 401/04, 403/12, 417/12, 405/12, 471/04, A61P31/12, 1/16, 43/00 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC B. FIELDS SEARCHED					
Minimum documenta Int.Cl ⁷ A 31/506, 3 403/12, 4	tion searched (classification system followed b A61K31/4184, 31/4439, 31/42 1/437, C07D235/18, 235/30, 17/12, 405/12, 471/04, A61	, 31/4523, 3 409/12, 403 .P31/12, 1/1	1/496, 31/5 L/12, 413/12 6, 43/00	2, 401/04,	
Jitsuyo Sh Kokai Jits	Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Jitsuyo Shinan Koho 1940-1992 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-1996 Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-1992 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2002				
Electronic data base CAPLUS (ST	consulted during the international search (name	of data base and, wh	ere practicable, sear	ch terms used)	
C. DOCUMENTS	CONSIDERED TO BE RELEVANT			,	
Category* C	itation of document, with indication, where app	propriate, of the relev	ant passages	Relevant to claim No.	
Y 01	06-025182 A (Kanebo, Ltd.) February, 1994 (01.02.94), mily: none)	,		86,87 74,75 1-73,82-85	
Y 07	EP 507650 A1 (Synthelabo S.A.), 07 October, 1992 (07.10.92), & JP 05-112563 A2 & US 5280030 A		86,87 74,75 1-73,82-85		
Y 16	EP 10063 A2 (Ciba-Geigy AG.), 16 April, 1980 (16.04.80), & JP 55-049374 A		86,87 74,75 1-73,82-85		
Y tin A Khi	Kataev, V.A. et al., Preparation and immunomodula ting effect of (1-thietanyl-3)benzimidazoles., Khimiko-Farmatsevticheskii Zhurnal, Vol.30, No.7 (1996), pages 22 to 24		86,87 74,75 1-73,82-85		
▼ Further docur	nents are listed in the continuation of Box C.	See patent far	nily annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention document of particular relevance; the claimed invention cannot considered novel or cannot be considered to involve an invention step when the document is taken alone "Y" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed Date of the actual completion of the international search 02 September, 2002 (02.09.02) Take document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention cannot document of particular relevance; the claimed invention cannot considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art document member of the same patent family Date of mailing of the international search report 17 September, 2002 (17.09.02)			he application but cited to derlying the invention cannot be bred to involve an inventive e claimed invention cannot be claimed invention cannot be p when the document is n documents, such a skilled in the art family		
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office		Authorized officer			
Facsimile No.		Telephone No.			

International application No.
PCT/JP02/06405

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.	
Y	WO 99/24060 A1 (Mayo Foundation for Medical Education and Research), 20 May, 1999 (20.05.99), & EP 1028745 A & JP 2001-522811 A	74,75	
Y	WO 97/41884 Al (Pharma Pacific PTY. Ltd.), 13 November, 1997 (13.11.97), & EP 906119 A & US 5997858 A & JP 12-505478 A	74,75	
P,X	WO 01/47883 Al (Japan Tobacco Inc.), 05 July, 2001 (05.07.01), & EP 1162196 Al & JP 2001-247550 A	1-75,82-87	
P,X	WO 02/04425 A2 (Boehringer Ingelheim Ltd.), 17 January, 2002 (17.01.02), & US 2002065418 A	1-75,82-87	
A	WO 96/07646 A1 (Wellcome Foundation Ltd.), 14 March, 1996 (14.03.96), & US 5534535 A & EP 779885 A1 & JP 10-505092 A	1-75,82-87	
A	WO 97/25316 A1 (Glaxo Group Ltd.) 17 July, 1997 (17.07.97), & EP 886635 A1 & JP 2000-503017 A & US 5998398 A	1-75,82-87	
	•		
		4	

International application No.
PCT/JP02/06405

Box I	Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)
This inte	mational search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:
and Auth	Claims Nos.: 76-81 because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely: aims 76 to 81 pertain to methods for treatment of the human body by therapy thus relate to a subject matter which this International Searching ority is not required, under the provisions of Article 17(2)(a)(i) of PCT and Rule 39.1(iV) of the Regulations under the PCT, to search. Claims Nos.: because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3.	Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).
Box II	Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)
Si in c as s	emational Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows: nce the invention as set forth in claim 71 and the inventions as set forth laims 72 and 73 relate to intermediates in different parts of the invention et forth in claim 29, these inventions are not regarded as having a common unical feature.
1.	As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable
*• Ш	claims.
2. X	As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3.	As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4.	No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:
Remarl	The additional search fees were accompanied by the applicant's protest. No protest accompanied the payment of additional search fees.

International application No.
PCT/JP02/06405

Claims 1 to 5, 11 to 28, 74, 75 and 82 to 87 involve a great number of compounds in the scopes thereof. However, only parts of the claimed compounds are supported by the description in the meaning as defined in PCT Article 6 and disclosed therein in the meaning as defined in PCT Article 5.

Such being the case, this search has been made on the parts supported by the description and disclosed therein, i.e., the compounds as set forth in claims 6 to 10 and 29 to 73.

A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int. Cl⁷ A61K31/4184, 31/4439, 31/42, 31/4523, 31/496, 31/55, 3 1/427, 31/506, 31/437, C07D235/18, 235/30, 409/12, 401/12, 413/12, 401/04, 403/12, 417/12, 405/12, 471/04, A61P31/12, 1/16, 43/00

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int. Cl⁷ A61K31/4184, 31/4439, 31/42, 31/4523, 31/496, 31/55, 3 1/427, 31/506, 31/437, C07D235/18, 235/30, 409/12, 401/12, 413/12, 401/04, 403/12, 417/12, 405/12, 471/04, A61P31/12, 1/16, 43/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報

1940-1992年

日本国公開実用新案公報

1971-1992年

日本国登録実用新案公報

1994-1996年

日本国実用新案登録公報

1996-2002年

国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS (STN) , REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X Y A	JP 06-025182 A(鐘紡株式会社)1994.02.01 (ファミリーなし)	86, 87 74, 75 1–73, 82–85
X Y A	EP 507650 A1(Synthelabo S. A.)1992.10.07 & JP 05-112563 A2 & US 5280030 A	86, 87 74, 75 1–73, 82–85

区欄の続きにも文献が列挙されている。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示す もの
- 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日 以後に公表されたもの
- 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行 日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する 文献(理由を付す)
- 「〇」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
- 「P」国際出願目前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

- 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって 出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論 の理解のために引用するもの
- 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明 の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
- 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以 上の文献との、当業者にとって自明である組合せに よって進歩性がないと考えられるもの
- 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

02.09.02

国際調査報告の発送日 17.09.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁(ISA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号 特許庁審査官(権限のある職員) 田村 聖子 4C 9051

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

C (続き).	関連すると認められる文献	
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X Y A	EP 10063 A2(Ciba-Geigy AG.)1980.04.16 & JP 55-049374 A	86, 87 74, 75 1-73, 82-85
X Y A	Kataev, V. A. et. al., Preparation and immunomodulating eff ect of (1-thietanyl-3)benzimidazoles., Khimiko-Farmatsevtich eskii Zhurnal, Vol. 30, No. 7(1996)P. 22-24	86, 87 74, 75 1–73, 82–85
. У	WO 99/24060 A1(MAYO FOUNDATION for MEDICAL EDUCATION and RE SEARCH)1999.05.20 & EP 1028745 A & JP 2001-522811 A	74, 75
Y	WO 97/41884 A1(PHARMA PACIFIC PTY. LTD.)1997.11.13 & EP 906119 A & US 5997858 A & JP 12-505478 A	74, 75
PX	WO 01/47883 A1(Japan Tobacco Inc.)2001.07.05 & EP 1162196 A1 & JP 2001-247550 A	1-75, 82-87
PX	WO 02/04425 A2(Boehringer Ingelheim Ltd.)2002.01.17 & US 2002065418 A	1-75, 82-87
A	WO 96/07646 A1(Wellcome Foundation Limited)1996.03.14 & US 5534535 A & EP 779885 A1 & JP 10-505092 A	1-75, 82-87
A	WO 97/25316 A1(Glaxo Group Ltd.)1997.07.17 & EP 886635 A1 & JP 2000-503017 A & US 5998398 A	1-75, 82-87
	·	
	-	
	•	ø
	·	-
	No. A	40

第 I 欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見(第1ページの2の続き)	
法第8条第3項 (PCT17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の-	一部について作
成しなかった。	- 11
1. X 請求の範囲 $76-81$ は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係る	ものである。
つまり、	
_ 請求の範囲 7 6 ~ 8 1 は、治療による人体の処置方法に関するものであって	T、PCT
第17条(2)(a)(i)及びPCT規則39.1(iV)の規定により、	この国際
調査機関が国際調査を行うことを要しない対象に係るものである。	
2. 請求の範囲 は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の専件	2- NH-2- 1
	を満たしてい
ない国際出願の部分に係るものである。つまり、	
3. □ 請求の範囲 は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第	3文の相定に
従って記載されていない。	- NEVERC
· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	
第Ⅱ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見(第1ページの3の続き)	
•	
次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。	
請求の範囲71に記載の発明と、請求の範囲72及び73に記載の発明は、請求	の範囲2
9に記載の発明の異なる部分の中間体にかかるものであるから、両者は、技術的特	徴を共有
するものとは認められない。	
1	H
1. 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調の無限の必て作品した	間金り配な請求
の範囲について作成した。	
2. X 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することがて	3±±~~ '-
2. X 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することがて 加調査手数料の納付を求めなかった。	ござたので、追
AHPPUに上って対外でインアプロンで、オスタン・ムル・・ンノに。	
3. 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告に	ナー工粉型の外
3. [] 山嶼人が必要な追加調査子数杯を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告に 付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。	*、ナ数科の剂
1.1 ×2 のフラブにかく。 2 由日 2 × 2 本日 下口 × 2 本日 トロップ・ファップ・コップ・ファップ・ファップ・ファップ・ファップ・ファップ・ファップ・ファップ・ファ	
4. Ш 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲	明の最初に記載し
されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。	コーンスというして日口中次
The state of the s	
13.	
	4.5
追加調査手数料の異議の申立てに関する注意	
□ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。	
追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。	
Transit Control of the Control of th	

請求の範囲 $1\sim5$ 、 $11\sim28$ 、74、75、 $82\sim87$ は、非常に多数の化合物を包含している。しかしながら、PCT6条の意味において明細書に裏付けられ、また、PCT5条の意味において開示されているのは、クレームされた化合物のごくわずかな部分にすぎない。

よって、調査は、明細書に裏付けられ、開示されている部分、すなわち、請求の範囲 6 \sim 1 0 、 2 9 \sim 7 3 に記載された化合物に関して行った。